PCT

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071--00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

Industria y C
SUPERINTENDENCIA

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO INVENTARIO

División de Nuevas Creaciones

& P

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** 11-58071

54. **TÍTULO** DERIVADOS DE CHROMAN(1)-AZINYLAMINA SUSTITUIDOS COMO AGENTES PROTECTORES DE PLANTAS.

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL** _____

71. **SOLICITANTE** BAYER CROPSCIENCE AG.

DOMICILIO MONHEIM, ALEMANIA.

74. **APODERADO** ALVARO CORREA ORDOÑEZ.

22. **BOGOTÁ, D.C.,** MAYO 11, 2011.

13-06-2011

(FORMA P-10)

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071--00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

ión

FORMULARIO ÚNICO DE S
PC
ENTRADA EN FA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

SOLIC

(1)

[X] Patente de Invención [ ] Patente de Modelo de Utilidad

[X] Capítulo I. [ ] Capítulo II.

(2) SOLICITANTE (71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG

Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50 40789 Monheim (DE)

Nacionalidad o Domicilio: Alemania

Lugar de Constitución: Alemania

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 5

Teléfono: 6341500 Fax: 3762211

E-Mail: alvaro.correa@bakermckenzie.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).

(4) INVENTOR (ES) (72)

Nombre: BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DAHMEN, Peter; DUNKEL, Ralf; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HADANO, Hiroyuki; RINOLFI, Philippe; VOERSTE, Arnd; VORS, Jean-Pierre; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike.

Dirección: 4 allée Jean Lacarelle F-69230 Saint Genis-Laval (FR); Amselstrasse 7 42799 Leichlingen (DE); 18 rue de la Quarantaine F-69005 Lyon (FR); 56 cours de la Liberté F-69003 Lyon (FR); Altebrückerstraße 63 41470 Neuss (DE); Am Krähwinkeler Bach 9 42799 Leichlingen-Krähwinkel (DE); Am Sandberg 30a 42799 Leichlingen (DE); Le Trève Collonge Route d'Albigny F-69250 Curis au Mont d'Or (FR); 3-2-18 Gion Shimotsuke-shi Shimotsuke-shi , Tochigi 329-0434 (JP); Résidence le Coteau lieu dit la Colletière F-69380 Chatillon d'Azergues (FR); Mozartstraße 3-5 50674 Köln (DE); 6 allée Adanson F-69110 Sainte-Foy-Les-Lyon (FR); Oberer Markenweg 85 56566 Neuwied (DE)

Nacionalidad o Domicilio: Alemania y Francia respectivamente

(5) PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2009/065018 Fecha 12/11/2009

Publicación Internacional No. WO/2010/055077 Fecha 20/05/2010

(6) Título (54) Derivados de (piridil)-azinilamina sustituido como agentes protectores de plantas

(7) Clasificación Internacional (51) C07D 401/12; C07D 401/14; C07D 405/14; C07D 409/14; C07D 413/14; A01N 43/54; A01N 43/66.

(8) Prioridad

SI [X] NO [ ]

(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
EP	13/11/2008	08356139.9

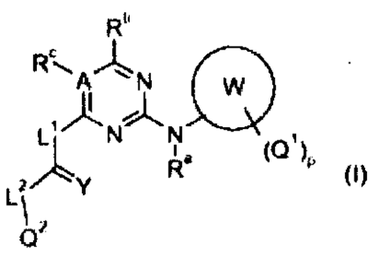
(9) Comprobante de pago No. 11-0010219,11-0042691,11-0042616,11-0042615,11-0014254711-0024430 **Fecha** 02/02/201105/05/2011,05/05/2011,05/05/201118/03/2011

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

(10) ANEXOS

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- [X] Poderes, si fuere el caso. . Ver documento de Poder General radicado en el Expediente No. 10.099.960
- [ ] Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- [ ] Declaraciones
- [X] Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- [X] 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.
- [X] Otros: Extractos

(11) FIGURA CARATERISTICA



(I)

(12) Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

FIRMA:

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

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

2011/008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0010219

Bogotá D.C., Febrero 02 de 2011 - 17:09:59

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	387471556	02/02/2011	121.118.700.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCION	571.000.00	571.000.00
				$571.000.00

SON: **QUINIENTOS SETENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
***

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. ____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

2A
2011/005

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0042691

Bogotá D.C., Mayo 05 de 2011 - 07:17:18

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	444391496	04/05/2011	78.375.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1642 S.DISTINTIVO CAMBIOO TITULARIDAT-TRANSFERENCIA INSCRIPC	361.000.00	361.000.00
				$361.000.00

SON: **TRESCIENTOS SESENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071--00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

3B

2011/006

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0042616

Bogotá D.C., Mayo 05 de 2011 - 07:17:18

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	444391496	04/05/2011	78.375.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMITE	27.000.00	27.000.00
				$27.000.00

SON: **VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act: 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act: 411 PRESENTACION Folios: 339

3C

2011/006

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0042615

Bogotá D.C., Mayo 05 de 2011 - 07:17:18

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	444391496	04/05/2011	78.375 000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMITE	27.000.00	27.000.00
				$27.000.00

SON: **VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

2011/006 30

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0042547

Bogotá D.C., Mayo 05 de 2011 - 07:17:18

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	444391496	04/05/2011	78.375.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS	10.000.00	10.000.00
				$10.000.00

SON: **DIEZ MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
-**-

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058077- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

2011/0043E

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0024430

Bogotá D.C., Marzo 18 de 2011 - 06:45:57

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325068785	17/03/2011	113.170.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS	7.000.00	7.000.00
				$7.000.00

SON: **SIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
-***-
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

PATENTE DE INVENCION ___ PCT X MODELO DE UTILIDAD ___ DISEÑO INDUSTRIAL ___

(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud:
(51) Clasificación Internacional :

(71)Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG

(72) Inventor (es): BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DAHMEN, Peter; DUNKEL, Ralf; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HADANO, Hiroyuki; RINOLFI, Philippe; VOERSTE, Arnd; VORS, Jean-Pierre; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike.

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad	(31) *No. Prioridad*	32) *Fecha*	(33) *País*
	08356139.9	13/11/2008	EP

(85) Fecha inicio fase nacional: 13/06/2011
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 12/11/2009
No. de solicitud PCT/EP2009/065018

(87) Publicación internacional
Fecha: 20/05/2010
N° publicación: WO/2010/055077

(54) Titulo: Derivados de (piridil)-azinilamina sustituido como agentes protectores de plantas

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO TEMATICO

PATENTE DE INVENCION ____ PCT _X_ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ___

(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud:
(51) Clasificación Internacional :

(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG

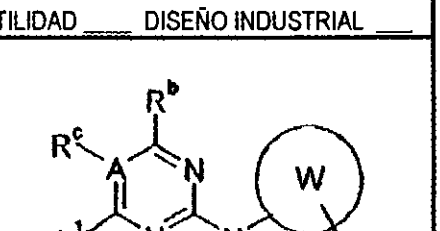
(72) Inventor(es) BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DAHMEN, Peter; DUNKEL, Ralf; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HADANO, Hiroyuki; RINOLFI, Philippe; VOERSTE, Arnd; VORS, Jean-Pierre; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike.

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad	(31) *No. Prioridad*	32) *Fecha*	(33) *País*
	08356139.9	13/11/2008	EP

(85) Fecha límite inicio fase nacional: 13/06/2011
(86) Datos relativos a la presentación de la solic. PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 12/11/2009
No. de solicitud PCT/EP2009/065018

(87) Publicación internacional:
Fecha: 20/05/2010
No. Publicación : WO/2010/055077



(I)

(54) Titulo: Derivados de (piridil)-azinilamina sustituido como agentes protectores de plantas

(57) Resumen:
La presente invención se refiere a derivados de fenil-pirimidinil-amino de fórmula (I) en la que Q^1 y p, R^a a R^c, L^1, y, L^2 y Q^2 representan varios sustituyentes, a su procedimiento de preparación, a la preparación de compuestos intermedios, a su uso como agentes fungicidas activos, en particular en forma de composiciones fungicidas, y a los métodos para reprimir los hongos fitopatógenos, en particular de plantas, usando estos compuestos o composiciones.

CONTINUA AL RESPALDO ...

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

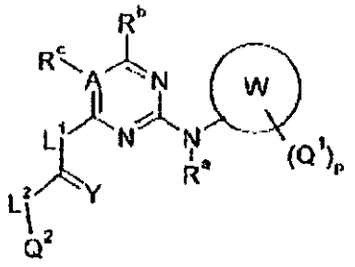
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

(21) N° de solicitud:	(51) Int Cl:
22) Fecha de solicitud:	(71)Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG
(30) Prioridad (31) ***No. Prioridad*** 08356139.9 32) ***Fecha*** 13/11/2008 (33) ***País*** EP	(72) Inventor(es) BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DAHMEN, Peter; DUNKEL, Ralf; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HADANO, Hiroyuki; RINOLFI, Philippe; VOERSTE, Arnd; VORS, Jean-Pierre; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike.
	(74) Apoderado: **Alvaro Correa Ordoñez**

(54) Titulo: Derivados de (piridil)-azinilamina sustituido como agentes protectores de plantas

Reivindicación(es):

1. Un derivado de piridil-azinilamino sustituido de fórmula (I)



(I)

En los que

- W representa fenilo con un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6, ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes.
- A representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno con la condición de que si A representa un átomo de carbono entonces W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes.
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8 , un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, una halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos ...

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING OF A CHANGE

(PCT Rule 92*bis*.1 and Administrative Instructions, Section 422)

To:

GUITTON, Carole
Bayer CropScience SA
Patents & Licensing Department
14-20 rue Pierre Baizet
F-69009 Lyon
FRANCE

Date of mailing *(day/month/year)*
02 June 2010 (02.06.2010)

Applicant's or agent's file reference
BCS 08-4020

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP2009/065018

International filing date *(day/month/year)*
12 November 2009 (12.11.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☐ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address
BAYER CROPSCIENCE SA
16, rue Jean-Marie Leclair
F-69009 Lyon
France

State of Nationality: FR
State of Residence: FR
Telephone No.:
Facsimile No.:
E-mail address:

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☒ the person ☐ the name ☐ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address
BAYER CROPSCIENCE AG
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
Germany

State of Nationality: DE
State of Residence: DE
Telephone No.:
Facsimile No.:
E-mail address:
☐ Notifications by e-mail authorized

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office
☐ the International Searching Authority
☐ the Authority(ies) specified for supplementary search
☐ the International Preliminary Examining Authority
☒ the designated Offices concerned
☐ the elected Offices concerned
☐ other:

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Authorized officer
Blanc Veronique
e-mail PT05.PCT@WIPO.INT
Telephone No. +41 22 338 74 05

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

(43) International Publication Date
20 May 2010 (20.05.2010)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2010/055077 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 401/12 (2006.01) *C07D 413/14* (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) *A01N 43/54* (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01) *A01N 43/66* (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/EP2009/065018

(22) International Filing Date:
12 November 2009 (12.11.2009)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
08356139.9 13 November 2008 (13.11.2008) 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)*: **BEIER, Christian** [DE/FR]; 4 allée Jean Lacarelle, F-69230 Saint Genis-Laval (FR). **BENTING, Jürgen** [DE/DE]; Amselstrasse 7, 42799 Leichlingen (DE). **CHRISTIAN, Isabelle** [FR/FR]; 18 rue de la Quarantaine, F-69005 Lyon (FR). **COQUERON, Pierre-Yves** [FR/FR]; 56 cours de la Liberté, F-69003 Lyon (FR). **DAHMEN, Peter** [DE/DE]; Altebrückerstraße 63, 41470 Neuss (DE). **DUNKEL, Ralf** [DE/DE]; Am Krähwinkeler Bach 9, 42799 Leichlingen-Krähwinkel (DE). **GREUL, Jörg** [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen (DE). **GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire** [FR/FR]; Le Trève Collonge, Route d'Albigny, F-69250 Curis au Mont d'Or (FR). **HADANO, Hiroyuki** [JP/JP]; 3-2-18 Gion Shimotsuke-shi, Shimotsuke-shi, Tochigi 329-0434 (JP). **RINOLFI, Philippe** [FR/FR]; Résidence le Coteau, lieu dit la Colletière, F-69380 Chatillon d'Azergues (FR). **VOERSTE, Arnd** [DE/DE]; Mozartstraße 3-5, 50674 Köln (DE). **VORS, Jean-Pierre** [FR/FR]; 6 allée Adanson, F-69110 Sainte-Foy-Les-Lyon (FR). **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike** [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE).

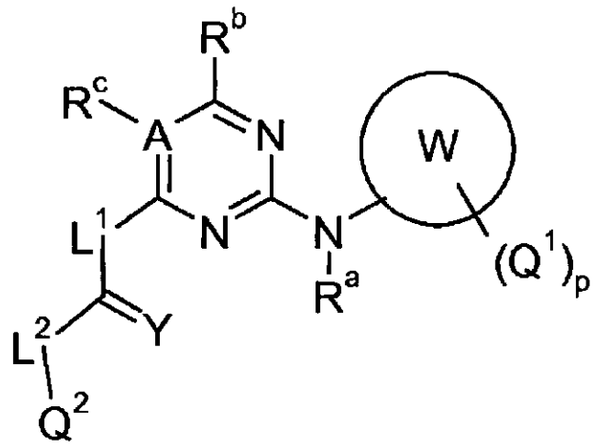
(74) Agent: **GUITTON, Carole**; Bayer CropScience SA, Patents & Licensing Department, 14-20 rue Pierre Baizet, F-69009 Lyon (FR).

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

[Continued on next page]

(54) Title: SUBSTITUTED (PYRIDYL)-AZINYLAMINE DERIVATIVES AS FUNGICIDES



(I)

(57) Abstract: The present invention relates to phenyl-pyrimidinyl-amino derivatives of formula (I) wherein Q^1 and p, R^a to R^c, L^1, Y, L^2 and Q^2 represent various substituents, their process of preparation, preparation intermediate compounds, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.

WO 2010/055077 A1

SUBSTITUTED (PYRIDYL)-AZINYLAMINE DERIVATIVES AS FUNGICIDES

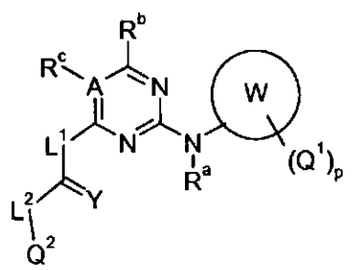
DESCRIPTION

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

WO 2007/003525 discloses N-Phenyl-triazinylamine derivatives useful as inhibitors of enzymes treating disease or disease symptoms. However, this reference does not relate to fungicidal applications of such derivatives. Additionally, WO 2005/019211 and WO 2005/033095 disclose a method of protecting plants against attack by phytopathogenic organisms using aminopyridinyl substituted N-Phenyl-triazinylamine derivatives. However, the said chemical structure of these compounds of the prior art is different from the compounds of the present invention.

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

Accordingly, the present invention provides N-substituted (pyridyl)-azinyl-amino derivatives of formula (I)



(I)

Wherein

- W represents phenyl or a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- A represents a carbon atom or a nitrogen atom provided that if A represents a carbon atom then W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- Q^1 independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_8-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino ; it being

possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkoxyalkyl, or a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxyalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylthioalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylthioalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, or a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- L^1 represents a substituted or non substituted pyridyl moiety;
- Y represents O, S, NR^d, CR^eR^f ;
- L^2 represents a direct bond, O, S, NR^g, CR^hR^i ;
- Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to

5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

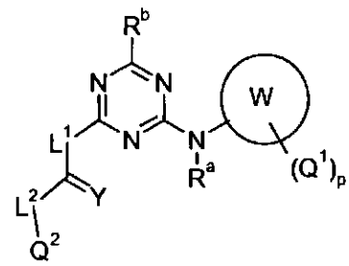
- Alternatively, L^2 and Q^2 can form together a substituted or non-substituted 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h and R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-

alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof; provided that the following compounds are excluded:

- (3-{[4-(2-ethenylpyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}phenyl)methanol;
- methyl 4-{4-[(3-{2-[(tert-butoxycarbonyl)amino]ethoxy}phenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-pyridine-2-carboxylate;
- N-{3-[(4-{2-[(1Z)-3-amino-2-chloroprop-1-en-1-yl]pyridin-4-yl}-1,3,5-triazin-2-yl)amino]-benzyl}-N-methylglycine.

In a particular embodiment of the invention, compounds of formula (I) according to the invention are those wherein A represents a nitrogen atom and W represents phenyl. A compound of formula (I) according to the invention is then represented by a compound of the Formula II:



(II)

wherein

- W represents phenyl
- Q^1 independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl,

benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkoxyalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxyalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylthioalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylthioalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- R^b represents a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- L^1 represents a substituted or non substituted pyridyl moiety;
- Y represents O, S, NR^d, CR^eR^f ;
- L^2 represents a direct bond, O, S, NR^g, CR^hR^i ;
- Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having

1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible

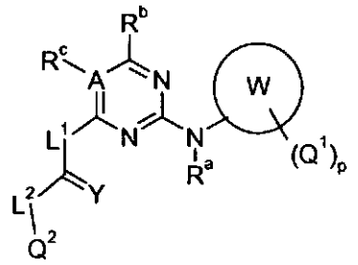
- Alternatively, L2 and Q2 can form together a substituted or non-substituted , 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h and R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-

alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof

In another particular embodiment of the invention, compounds of formula (I) according to the invention are those wherein W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different.

A compound of formula (I) according to the invention is then represented by a compound of the Formula (III):



(III)

wherein

- W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- A represents a carbon atom or a nitrogen atom
- Q^1 independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- p represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;

- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkoxyalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxyalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylthioalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylthioalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- L^1 represents a substituted or non substituted pyridyl moiety;
- Y represents O, S, NR^d, CR^eR^f ;
- L^2 represents a direct bond, O, S, NR^g, CR^hR^i ;
- Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-

alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

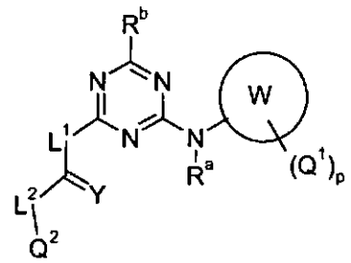
- Alternatively, L2 and Q2 can form together a substituted or non-substituted , 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h and R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having

1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof.

In another particular embodiment of the invention, compounds of formula (III) according to the invention are those wherein A represents a nitrogen atom.

A compound of formula (I) according to the invention is then represented by a compound of the Formula (III_1):



(III_1)

wherein

- W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- Q^1 independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group,

a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_8-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_6-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkoxyalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxyalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms,

a C_1-C_8-alkylthioalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylthioalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- L^1 represents a substituted or non substituted pyridyl moiety;
- Y represents O, S, NR^d, CR^eR^f ;
- L^2 represents a direct bond, O, S, NR^g, CR^hR^i ;
- Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

(2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

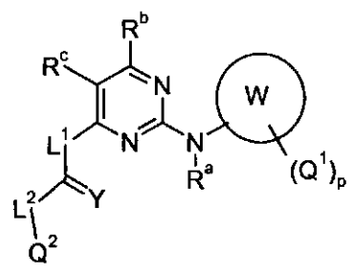
- Alternatively, L2 and Q2 can form together a substituted or non-substituted , 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h and R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-

oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof.

In another particular embodiment of the invention, compounds of formula (III) according to the invention are those wherein A represents a carbon atom.

A compound of formula (I) according to the invention is then represented by a compound of the Formula (III_2)



(III_2)

wherein

- W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- Q^1 independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-

halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkoxyalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxyalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylthioalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylthioalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- L^1 represents a substituted or non substituted pyridyl moiety;

- Y represents O, S, NR^d, CR^eR^f ;
- L^2 represents a direct bond, O, S, NR^g, CR^hR^i ;
- Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- Alternatively, L2 and Q2 can form together a substituted or non-substituted , 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h and R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof.

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

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

Any compound of formulas (I, II, III, III_1, III_2) according to the invention wherein L^2Q^2 represents a hydroxy group, a sulfanyl group or an amino group can exist in a tautomeric form resulting from the shift of the proton of said hydroxy group, sulfanyl group or amino group respectively. Such tautomeric forms are also part of the present invention. Generally, any tautomeric form of a compound of formulas (I, II, III, III_1, III_2) according to the invention wherein L^2Q^2 represents a hydroxy group, a sulfanyl group or an amino group, as well as the tautomeric forms of the compounds which can optionally be used as intermediates in the preparation processes according to the invention are also part of the present invention.

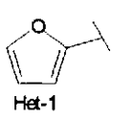
According to the invention, the following generic terms are generally used with the following meanings:

- halogen means fluorine, chlorine, bromine or iodine;
- heteroatom can be nitrogen, oxygen or sulphur;
- unless indicated otherwise, a group or a substituent that is substituted according to the invention can be substituted by one or more of the following groups or atoms: a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_8-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino.

Preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein W represents phenyl.

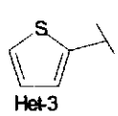
Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic heterocycle selected in the list consisting of:



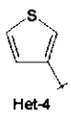
Het-1 ;



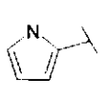
Het-2 ;



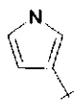
Het-3 ;



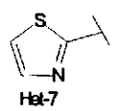
Het-4 ;



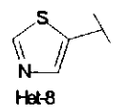
Het-5 ;



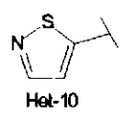
Het-6 ;

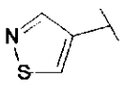


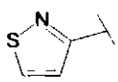
Het-7 ;

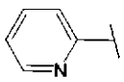

Het-8 ;

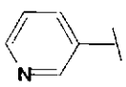

Het-9 ;

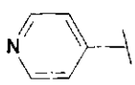

Het-10 ;


Het-11


Het-12


Het-13 ;


Het-14 ;


Het-15 .

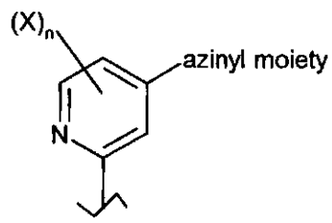
Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q^1 represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein p represents 0, 1, 2, or 3. More preferably, p represents 0 or 1. Even more preferably p represents 1.

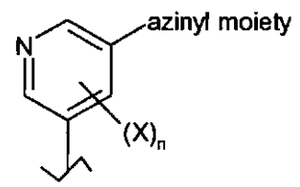
Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^a represents a hydrogen atom or a substituted or non substituted C_1-C_8-cycloalkyl.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms. More preferably, R^b and R^c independently represent a hydrogen atom or a halogen atom.

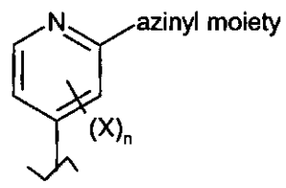
Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein L^1 is selected in the list consisting of :



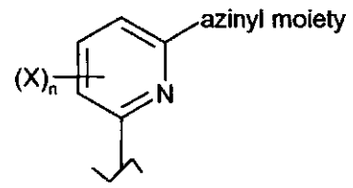
L^{1a}



L^{1b}



L^{1c}

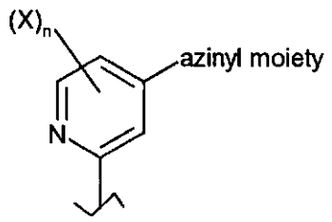


L^{1d}

wherein

- n represents 0, 1, 2 or 3;
- X independently represents a C_1-C_{10}-alkyl, a C_1-C_{10}-halogenoalkyl, a halogen atom or a cyano.

More preferred compounds of of formula (I) according to the invention are those wherein L^1 represents

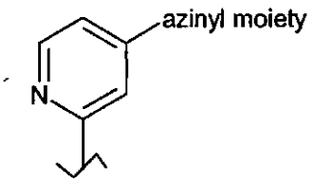


L^{1a}

wherein

- n represents 0, 1, 2 or 3;
- X independently represents a C_1-C_{10}-alkyl, a C_1-C_{10}-halogenoalkyl, a halogen atom or a cyano.

Even more preferred compounds of of formula (I) according to the invention are those wherein L^1 represents



L^{1a}

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl)

C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

When L^2 and Q^2 form together a , 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, preferred resulting heterocycles are non-aromatic. More preferred heterocycles are pyrolidine, piperidine, morpholine.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^d to R^l independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible.

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

represents H, (methoxycarbonyl)amino, (4-chlorophenyl)amino, [3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]amino, (2-ethoxy-2-oxoethyl)amino, (2,2,2-trifluoroethyl)amino, (2-cyanoethyl)amino, methylamino, (2-methylpropanoyl)oxy, (3-methylbut-2-enoyl)oxy, (3-methylbutanoyl)oxy, butanoyloxy, propanoyloxy, (methoxyacetyl)oxy, acetyloxy, cyclopentyloxy, dicyclopropylmethoxy, 1-cyclopropylethoxy, but-3-yn-2-yloxy, hex-2-yn-1-yloxy, but-2-yn-1-yloxy, prop-2-yn-1-yloxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, (2,6-dichlorobenzyl)oxy, (4-chlorobenzyl)oxy, (4-methoxybenzyl)oxy, benzyloxy, cyclopropylmethoxy, 2-methylpropoxy, prop-2-en-1-yloxy, propoxy, 2-(dimethylamino)ethoxy, ethoxy, methoxy, hydroxyl, phenylamino, or phenyl hetarylamino.

Other more preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^9 represents Hydrogen, prop-2-en-1-yl, hexyl, butyl, propyl, 2-hydroxyethyl, ethyl, methyl.

Other more preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q^2 represents (2R)-2-(methoxymethyl)pyrrolidin-1-yl, (2S)-1-methoxypropan-2-yl, 1-(diethylamino)propan-2-yl, 1-(dimethylamino)propan-2-yl, 1,1-dioxidotetrahydrothiophen-3-yl, 1,3-dimethoxypropan-2-yl, 1-cyanobutan-2-yl, 1-cyclopropyl-2-methoxyethyl, 1-ethylpiperidin-3-yl, 1-methoxybutan-2-yl, 1-methoxypropan-2-yl, 2-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl, 2-(morpholin-4-yl)ethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2,3-dimethylpiperidin-1-yl, 2,5-dimethylpyrrolidin-1-yl, 2,6-dimethylmorpholin-4-yl, 2-cyanoethyl, 2-ethylpiperidin-1-yl, 2-hydroxy-2-methylpropyl, 2-hydroxyethyl, 2-methoxyethyl, 2-methylpiperidin-1-yl, 2-methylprop-2-en-1-yl, 2-methylpropyl, 2-methylpyrrolidin-1-yl, 3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl, 3-(2-oxopyrrolidin-1-yl)propyl, 3-(formylamino)propyl, 3-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl, 3,3,3-trifluoropropyl, 3,3-dimethylpiperidin-1-yl, 3,5-dimethylpiperidin-1-yl, 3,6-dihydropyridin-1(2H)-yl, 3-hydroxypiperidin-1-yl, 3-hydroxypropyl, 3-hydroxypyrrolidin-1-yl, 3-methoxybutan-2-yl, 3-methoxypiperidin-1-yl, 3-methoxypropyl, 3-methylbut-2-en-1-yl, 3-methylbutan-2-yl, 3-methylbutyl, 3-methylpiperidin-1-yl, 4-(2-oxopyrrolidin-1-yl)butyl, 4-(trifluoromethyl)piperidin-1-yl, 4-cyanopiperidin-1-yl, 4-ethoxycyclohexyl, 4-formylpiperazin-1-yl, 4-hydroxypiperidin-1-yl, 4-methoxypiperidin-1-yl, 4-methylpiperazin-1-yl, 4-methylpiperidin-1-yl, 4-oxoimidazolidin-1-yl, azepan-1-yl, butan-2-yl, butyl, cyclobutyl, cyclohexyl, cyclopentyl, cyclopropyl, cyclopropylmethyl, ethyl, hydrogen, hexyl, hydroxy, methoxy, methyl, morpholin-4-yl, oxetan-3-yl, pentan-2-yl, pentan-3-yl, pentyl, piperidin-1-yl, prop-2-en-1-yl, propan-2-yl, propyl, pyrrolidin-1-yl, tert-butyl, tetrahydrofuran-2-ylmethyl, thiomorpholin-4-yl.

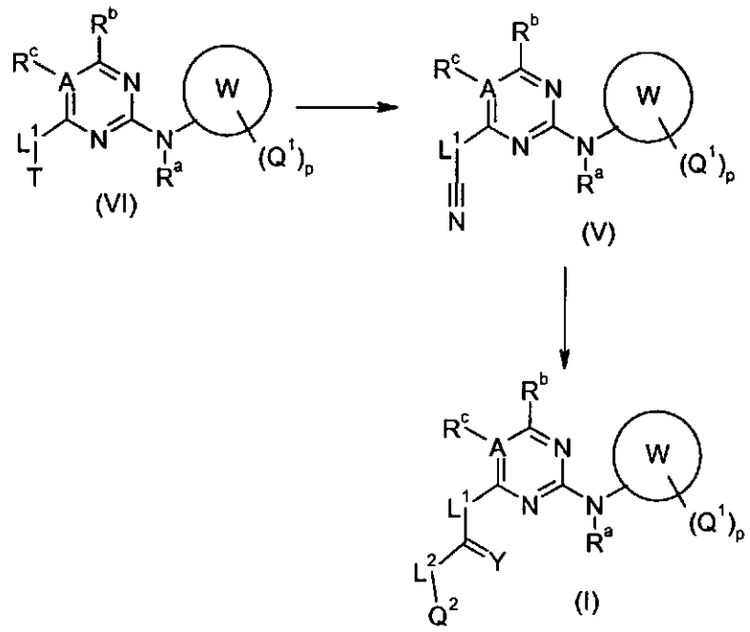
The above mentioned preferences with regard to the substituents of the compounds of formula (I) according to the invention can be combined in various manners, either individually, partially or entirely. These combinations of preferred features thus provide sub-classes of compounds according to the invention.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

- preferred features of W with preferred features of one or more of Q^1 and p, R^a to R^i, L^1, Y, L^2 and Q^2;
- preferred features of Q^1 and p with preferred features of one or more of W, R^a to R^i, L^1, Y, L^2 and Q^2;
- preferred features of R^a to R^i with preferred features of one or more of W, Q^1 and p, L^1, Y, L^2 and Q^2;
- preferred features of L^1 with preferred features of one or more of W, Q^1 and p, R^a to R^i, Y, L^2 and Q^2;
- preferred features of Y with preferred features of one or more of W, Q^1 and p, R^a to R^i, L^1, L^2 and Q^2;
- preferred features of L^2 with preferred features of one or more of W, Q^1 and p, R^a to R^i, L^1, Y and Q^2;
- preferred features of Q^2 with preferred features of one or more of W, Q^1 and p, R^a to R^i, L^1, Y and L^2.

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 W, Q^1 and p, R^a to R^i, L^1, Y, L^2 and Q^2 so as to form most preferred subclasses of compounds according to the invention.

The preferred features of the other substituents of the compounds according to the invention can also be part of such sub-classes of preferred compounds according to the invention, notably the groups of substituents W, Q^1 and p, R^a to R^i, L^1, Y, L^2 and Q^2.

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



Process P1

wherein

- T represents a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substitued phenylsulfonate and
- if Y represents an oxygen atom and L^2 represents CR^hR^i;
- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1, Q^2 being as herein-defined; and that comprises
  - reacting a compound of formula (VI) with a cyanide reagent such as a metallic cyanide for example sodium cyanide, potassium cyanide, zinc cyanide; a metalloïdic cyanide, an organo-metallic cyanide for example di-C_1-C_6-alkylaluminum cyanide notably di-ethylaluminum cyanide; an organo-metalloïdic cyanide for example tri-C_1-C_6-alkylsilylcyanide notably tri-methylsilylcyanide in order to yield a compound of formula (V), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-

(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine; to yield a compound of formula (V)

- then reacting said compound of formula (V) with an organo-metallic reagent of formula Q^2-L^2-M, wherein M represents a metal such as lithium, magnesium, sodium, potassium or a metallic salt such as magnesium salt, lithium salt, potassium salt or sodium salt ; to yield a compound of formula (I); optionally in the presence of a catalyst ;
- or by then reacting said compound of formula (V) with a phosporane ylide reagent of formula Q^2-L^2-U, wherein U represents a tri-(phenyl)-phosphonium group, a di-(C_1-C_6)-alkylphosphonate,; to yield a compound of formula (I); in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU); optionally in the presence of a catalyst ;

- if Y represents an oxygen atom , L^2 represents a direct bond and Q^2 represents a hydrogen atom;
- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c,L^1, being as herein defined; and that comprises
    - reacting a compound of formula (VI) with a cyanide reagent such as a metallic cyanide for example sodium cyanide, potassium cyanide, zinc cyanide; a metalloïdic cyanide, an organo-metallic cyanide for example di-C_1-C_6-alkylaluminum cyanide notably di-ethylaluminum cyanide; an organo-metalloïdic cyanide for example tri-C_1-C_6-alkylsilylcyanide notably tri-methylsilylcyanide in order to yield a compound of formula (V), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine; to yield a compound of formula (V),
    - reacting said compound of formula (V) with a reducing agent such as hydrogen, a metal, such as magnesium, a metallic salt such as $SnCl_2$ or $SnBr_2$; or a hydride donor of formula H-M, wherein M represents a metal, or a metallic salt,

such as di-C_1-C_6-alkylaluminum hydrides, notably di-ethylaluminum hydride, to yield a compound of formula (I); optionally in the presence of a catalyst ;

- if Y represents an oxygen atom, L^2 represents an oxygen atom and Q^2 represents a hydrogen atom;
- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c,L^1, being as herein defined; and that comprises
    - reacting a compound of formula (VI) with a cyanide reagent such as a metallic cyanide for example sodium cyanide, potassium cyanide, zinc cyanide; a metalloïdic cyanide, an organo-metallic cyanide for example di-C_1-C_6-alkylaluminum cyanide notably di-ethylaluminum cyanide; an organo-metalloïdic cyanide for example tri-C_1-C_6-alkylsilylcyanide notably tri-methylsilylcyanide in order to yield a compound of formula (V), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine; to yield a compound of formula (V),

- hydrolyzing said compound of formula (V), preferably in presence of water, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amine, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU); optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, or an organic acid, such as para-toluenesulphonic acid; to yield a compound of formula (I);

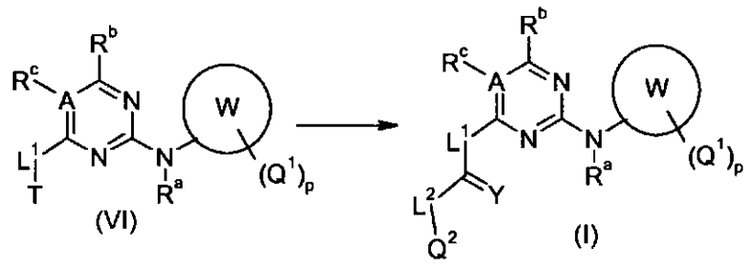
- if Y represents NH, L^2 represents a direct bond, a sulphur atom, an oxygen atom or NH, and Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-

oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylamino, phenoxy or phenylamino;

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, being as herein defined; and that comprises
  - reacting a compound of formula (VI) with a cyanide reagent such as a metallic cyanide for example sodium cyanide, potassium cyanide, zinc cyanide; a metalloïdic cyanide, an organo-metallic cyanide for example di-C_1-C_6-alkylaluminum cyanide notably di-ethylaluminum cyanide; an organo-metalloïdic cyanide for example tri-C_1-C_6-alkylsilylcyanide notably tri-methylsilylcyanide in order to yield a compound of formula (V), optionally in the presence of a catalyst, notably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine; to yield a compound of formula (V),

- performing the addition reaction of a compound of formula (V) with a reagent of formula Q^2-L^2-H, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amine, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU); optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid; optionally in the presence of a catalyst, to yield a compound of formula (I).

Advantageously, process P1 according to the invention can be simplified, allowing the direct preparation of certain compounds of formula (I) starting from a compound of formula (VI).
Accordingly, the present invention provides an improved process P1A for the preparation of a compound of formula (I), as illustrated by the following reaction scheme:



Process P1A

wherein

- T represents a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate; a substituted or non-substitued phenylsulfonate and
- if Y represents an oxygen atom, L^2 represents an oxygen atom, a NR^g group and R^g represents a hydrogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyloxy group, a formylamino group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S;
- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, Q^2 being as herein-defined; and that comprises
    - reacting a compound of formula (VI) with a compound of formula Q^2-L^2-H, wherein Q^2 is herein-defined and L^2 represents oxygen atom, a NR^g group and R^g represents a hydrogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyloxy group, a formylamino group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5

halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; in the presence of carbon monoxide or a carbon monoxide generating agent such as $Mo(CO)_6$ or $W(CO)_6$, optionally in the presence of a catalyst notably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate,

acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amine, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), to yield a compound of formula (I).

The process according to the invention also allows the preparation of compounds of formula (I) according to the invention using other compounds of formula (I) according to the invention as starting material.

Thus according to a further aspect of the present invention, there is provided a process P2 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group, L^2 represents CR^hR^i; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, R^h, R^i, L^1, Q^2 being as herein defined;
that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom and L^2 represents CR^hR^i; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1, Q^2 being as herein-defined ;
with a compound of formula R^dNH or one of its salts, wherein R^d is as herein-defined, optionally in the presence of a dehydrating agent such as molecular sieves, anhydrous metal salts, such as magnesium sulphate, sodium sulphate, or metal oxides such as barium oxide, calcium oxide, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides

such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P3 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a CR^eR^f group, L^2 represents an oxygen atom and Q^2 represents a formyl group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1, being as herein defined;

that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom, L^2 represents CR^hR^i and Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1, being as herein-defined;

with a compound of formula Q^2T wherein T represents a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate and Q^2 represents a formyl group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-

C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amine, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU).

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P4 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group, L^2 represents a direct bond and Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 being as herein defined,

and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom, L^2 represents a direct bond and Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 being as herein-defined;

with a compound of formula R^dNH or one of its salts, R^d being as herein-defined, optionally in the presence of dehydrating agent such as molecular sieves, anhydrous metal salts, such as magnesium sulphate, sodium sulphate, or metal oxides such as barium oxide, calcium oxide, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA),

tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P5 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a CR^eR^f group, L^2 represents a direct bond and Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 being as herein defined

and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom, L^2 represents a direct bond and Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 being as herein-defined ;

with a compound of formula $CHUR^eR^f$, wherein U represents a hydrogen atom, a phosphonium group, a di-(C_1-C_6)-alkylphosphonate, R^e, R^f being as herein-defined, or one of its salts, a tri-(C_1-C_6)-alkylsilyl, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P6 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a CR^eR^f group, L^2 represents CR^hR^i and A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^e, R^f, R^h, R^i, L^1, Q^2 being as herein-defined;
and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom and, L^2 represents CR^hR^i; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^e, R^f, R^h, R^i, L^1, Q^2 being as herein-defined;
with a compound of formula $CHUR^eR^f$ wherein U represents a hydrogen atom, a tri-(phenyl)-phosphonium group, a di-(C_1-C_6)-alkylphosphonate, R^e, R^f being as herein-defined, or one of its salts, a tri-(C_1-C_6)-alkylsilyl, optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P7 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group, L^2 represents an oxygen atom a sulphur atom or a NR^9 group wherein R^9 represents a hydrogen atom, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-

halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; Q^2 represents a formyl group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; and A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 being as herein-defined;

and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group, L^2 represents an oxygen atom, a sulphur atom or a NR^g group wherein R^g represents a hydrogen atom, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group,

(hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1, being as herein-defined;

with a compound of formula Q^2T wherein T represents a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate and Q^2 represents a formyl group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-

C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, a or a 4-, 5-, 6-, or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid, optionally in the presence of a condensing agent such as acid halide former, notably phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; such as an anhydride former, notably ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate, 2,2,-dimethylpropionyl chloride or methanesulfonyl chloride; notably carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or such as other customary condensing agents, notably phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphate, optionally in the presence of a catalyst notably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction

mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P8 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group wherein R^d represents a formyloxy group, a formylamino group, C_1-C_8-alkyl amino, C_1-C_8-cycloalkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkoxycarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkoxycarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms; L^2 represents an oxygen atom, a sulphur atom or a NR^g group; Q^2 represents a hydrogen atom; and A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g, L^1, being as herein-defined,

and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group wherein R^d represents an amino group, a hydroxy group C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-cycloalkylamino, L^2 represents an oxygen atom, a sulphur atom or a NR^g group; Q^2 represents a hydrogen atom; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g, L^1, being as herein-defined;

with a compound of formula Q^2T wherein T represents a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate and Q^2 represents a formyl group, C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_2-C_8-halogenoalkenyl having 1 to 5

halogen atoms, C_3-C_8-halogenoalkynyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid, optionally in the presence of a condensing agent such as acid halide former, notably phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; such as an anhydride former, notably ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate, 2,2-dimethylpropionyl chloride or methanesulfonyl chloride; notably carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or such as other customary condensing agents, notably phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphate, optionally in the presence of a catalyst notably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-

(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P9 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom, L^2 represents an oxygen atom, a NR^g group; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g , L^1, Q^2, being as herein defined;
and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom, L^2 represents an oxygen atom and Q^2 represents a hydrogen atom, a formyl group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, being as herein defined;
with a compound of formula Q^2L^2H wherein Q^2 being as herein defined and L^2 represents an oxygen atom, a NR^g group,
optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate

or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid, optionally in the presence of a condensing agent such as acid halide former, notably phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; such as an anhydride former, notably ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate, 2,2-dimethylpropionyl chloride or methanesulfonyl chloride; notably carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or such as other customary condensing agents, notably phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphate, optionally in the presence of a catalyst notably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-

(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine; in one or a different-pot conditions.

According to the present invention, the compounds of formula (I) useful as starting material within the processes P2 to P9 can be prepared according to process P1 according to the invention.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P10 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a sulphur atom, L^2 represents an oxygen atom, a NR^g group and A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g , L^1, Q^2 being as herein defined;
and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents an oxygen atom, L^2 represents an oxygen atom, a NR^g group and A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g, L^1, Q^2 being as herein defined;
with a thiocarbonylation agent such as 2,4-bis(4-methoxyphenyl)-1,3,2,4-dithiadiphosphetane 2,4-disulfide, phosphorus pentasulfide, sulphur.

According to a further aspect of the present invention, there is provided a process P11 for the preparation of a compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group or an oxygen atom, L^2 represents a NR^g group and R^g represents a hydrogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyloxy group, a formylamino group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-

halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1, Q^2 being as herein defined;

and that comprises reacting a different compound of formula (I) wherein Y represents a NR^d group or an oxygen atom, L^2 represents an oxygen atom, a sulphur atom; Q^2 represents a formyl group, C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_2-C_8-halogenoalkenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-halogenoalkynyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms and A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 being as herein defined;

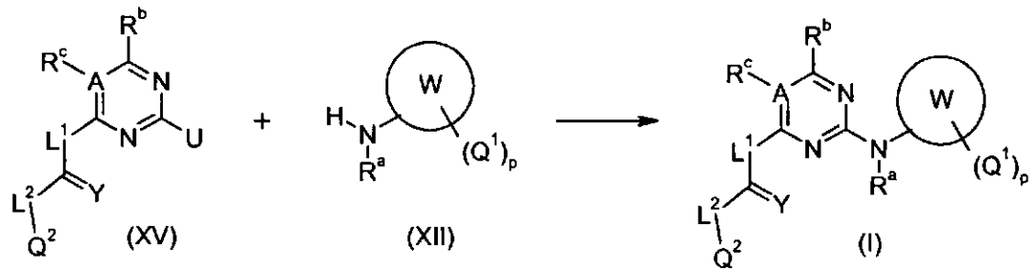
with a compound of formula R^9NH wherein R^9 being as herein defined;

optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base; notably an alkaline earth metal or an alkali metal hydride, hydroxide, amide, alcoholate, acetate, carbonate or hydrogen carbonate, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid, optionally in the presence of a condensing agent such as acid halide former, notably phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; such as an anhydride former, notably ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate, 2,2-dimethylpropionyl chloride or methanesulfonyl chloride; notably carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or such as other customary condensing agents, notably phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-

tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphate, optionally in the presence of a catalyst notably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine; in one or a different-pot conditions.

According to the present invention, the compounds of formula (I) useful as starting material within the processes P10 to P11 can be prepared according to process P1 to P9 according to the invention.

Thus according to a further aspect of the present invention, there is provided a process P12 for the preparation of a compound of formula (I) as illustrated by the following reaction scheme:



wherein

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, Y, L^2, Q^2being as herein-defined;
- U represents a hydrogen atom or a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulphenyl, a C_1-C_6 haloalkylsulphenyl ; a substituted or non-substitued

phenylsulphenyl, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substitued phenylsulfonate and that comprises

reacting a compound of formula (XV) with an amino derivative of formula (XII) in order to yield a compound of formula (I), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine, optionally in the presence of an organo-metallic reagent such as an organo-lithium reagent, for example *n*-butyl lithium, methyl lithium, phenyl lithium or an organo-magnesium halide reagent (Grignard reagent) such as isopropyl magnesium halide more preferably such as isopropyl magnesium chloride, optionally in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base, preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, 2,2,6,6-tetramethylpiperidylmagnesium chloride, lithium hexamethyldisilazide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane

(DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of a metallic salt such as an alkaline earth metal salt, an alkali metal salt, a transition metal salt such as a lithium salt, preferably a lithium halide, more preferably lithium chloride, such as a copper salt, preferably a copper(I) salt such as copper(I) chloride, copper(I) cyanide, in the presence of an oxidative agent such as oxygen, 3,3',5,5'-tetra-tert-butyldiphenoquinone, 2,3-dichloro-5,6-dicyano-1,4-benzoquinone (DDQ), and 2,3,5,6-tetrachloro-1,4-benzoquinone (chloranil), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid.

Suitable solvents for carrying out process P1 to P12 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, dichlorethane or trichlorethane; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl t-butyl ether, methyl t-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or i-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; esters, such as methyl acetate or ethyl acetate, sulphoxides, such as dimethyl sulphoxide, or sulphones, such as sulpholane.

When carrying out process P1 to P12 according to the invention, the reaction temperatures can independently be varied within a relatively wide range. Generally, processes according to the invention are carried out at temperatures between -80°C and 250°C.

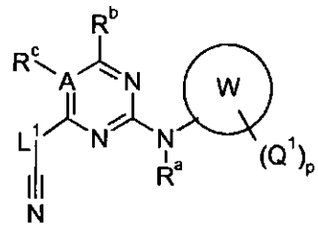
Process P1 to P12 according to the invention is generally independently carried out under atmospheric pressure. However, in each case, it is also possible to operate under elevated or reduced pressure.

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

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

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

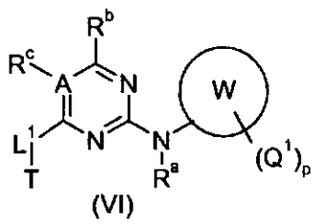
Still in a further aspect, the present invention relates to compounds of formula (V) useful as intermediate compounds or materials for the process of preparation according to the invention. The present invention thus provides compounds of formula (V)



(V)

wherein A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 are as herein-defined.

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



(VI)

wherein W, A, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, and T are as herein-defined, provided that the following compounds are excluded:

- N-(3-chlorophenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine
- 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine
- 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine

Preferred compounds of formula (VI) according to the invention are those wherein T is a chlorine atom.

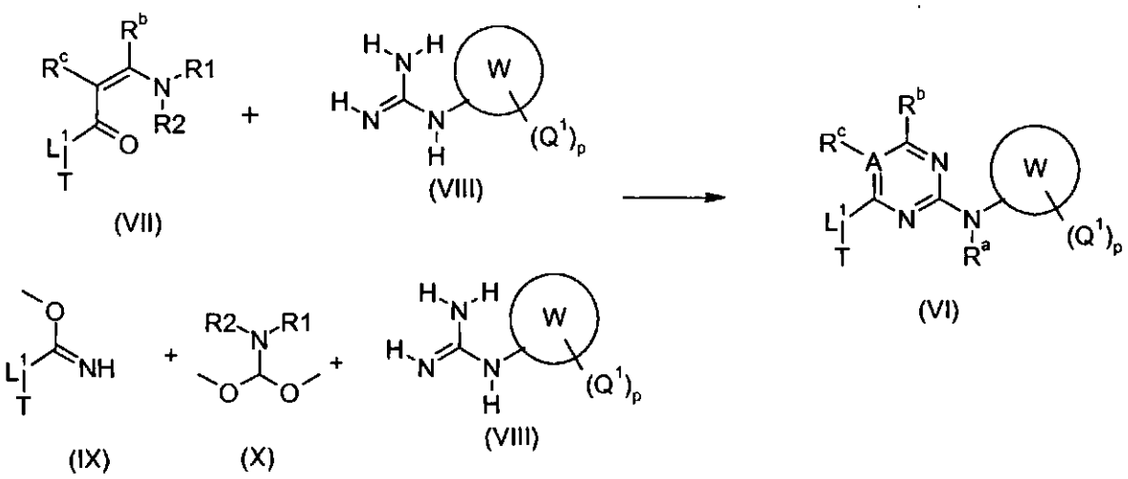
More preferred compounds of formula (VI) according to the invention are those selected from the group constituted of 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(pyridin-3-yl)pyrimidin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-methoxypyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 3-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}benzoic acid, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-chloropyridin-2-yl)pyrimidin-2-amine, N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-(1-methoxybutan-2-yl)pyridine-2,4-diamine, N-(3-chloro-4-fluorophenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(methylsulfanyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, N-(3-chloro-4-methylphenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-cyclobutylpyridine-2,4-diamine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-(3-methylbutan-2-yl)pyridine-2,4-diamine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-(pentan-3-yl)pyridine-2,4-diamine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(pyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, methyl 3-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}thiophene-2-carboxylate, ethyl 2-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}-4-methyl-1,3-thiazole-5-carboxylate, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(4-methyl-1,3-thiazol-2-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(5-methyl-1,3-thiazol-2-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(2-methylpyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, N-(2-bromopyridin-4-yl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, N-(5-bromopyridin-3-yl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[2-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl]pyrimidin-2-amine, 2-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}thiophene-3-carbonitrile, N-(5-chloro-3-methylpyridin-2-yl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(4-chloropyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(2-methylpyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)-N-(methoxymethyl)pyrimidin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(2,5-difluorophenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3-fluorophenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(methoxymethyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(thiophen-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(trifluoromethyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(propan-2-yl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(trifluoromethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-

chloropyridin-4-yl)-N-(3-ethoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-phenyl-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(4-fluorophenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(difluoromethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, N-(3-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}phenyl)acetamide, and 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(difluoromethyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(difluoromethyl)-4-fluorophenyl]-1,3,5-triazin-2-amine and N-[4-chloro-3-(difluoromethyl)phenyl]-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine

Compounds of formula (VI) useful as intermediates for the process of preparation of compounds of formula (I) or formula (V) may be prepared by various processes. Accordingly, there is provided a process A according to the invention for the preparation of a compound of formula (VI) wherein

- R^a represents a hydrogen atom;
- A, W, Q^1, p, R^b, R^c, L^1, T being as herein-defined; and comprising

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



Scheme A-1

wherein

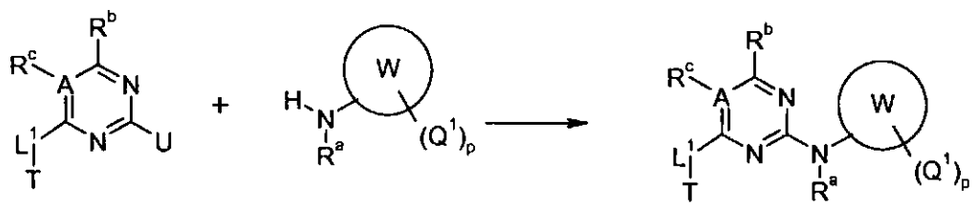
- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T being as herein-defined;
- R^1 and R^2 are independently a C_1-C_8-alkyl group, R^1 and R^2 can form together a , 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S;

that comprises the formation of the pyrimidine or triazine moiety by condensation, at a temperature of from -50°C to 200°C, of a compound of formula (VII) or formula (IX), this in presence a compound of formula (X), optionally in the presence of a base such as an inorganic

or an organic base, preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU); with a guanidine or a guanidine salt derivative of formula (VIII) to yield a compound of formula (VI).

Alternatively, there is provided a process B according to the invention for the preparation of a compound of formula (VI) wherein A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T being as herein-defined; and comprising

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



(XI) (XII) (VI)

Scheme B-1

wherein

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T being as herein-defined;
- U represents a hydrogen atom or a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulphenyl, a C_1-C_6 haloalkylsulphenyl ; a substituted or non-substitued phenylsulphenyl, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substitued phenylsulfonate and that comprises

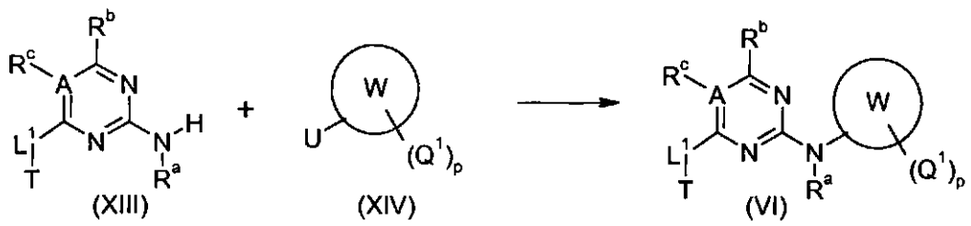
reacting a compound of formula (XI) with an amino derivative of formula (XII) in order to yield a compound of formula (VI), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative

the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine, optionally in the presence of an organo-metallic reagent such as an organo-lithium reagent, for example *n*-butyl lithium, methyl lithium, phenyl lithium or an organo-magnesium halide reagent (Grignard reagent) such as isopropyl magnesium halide more preferably such as isopropyl magnesium chloride, optionally in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base, preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, 2,2,6,6-tetramethylpiperidylmagnesium chloride, lithium hexamethyldisilazide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of a metallic salt such as an alkaline earth metal salt, an alkali metal salt, a transition metal salt such as a lithium salt, preferably a lithium halide, more preferably lithium chloride, such as a copper salt, preferably a copper(I) salt such as copper(I) chloride, copper(I) cyanide, in the presence of an oxidative agent such as oxygen, 3,3',5,5'-tetra-tert-butyldiphenoquinone, 2,3-dichloro-5,6-dicyano-1,4-benzoquinone (DDQ), and 2,3,5,6-tetrachloro-1,4-benzoquinone (chloranil), optionally in the presence of an acid such as a Lewis acid; notably metal or metalloïd halides such as aluminium trichloride, zinc dichloride, magnesium bromide, boron tribromide; or

such as a Brönstedt acid; notably a mineral acid such as sulphuric acid, chlorhydric acid, ammonium chloride, phosphoric acid, or an organic acid, such as acetic acid, para-toluenesulphonic acid.

Alternatively, there is provided a process C according to the invention for the preparation of a compound of formula (VI) wherein A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T, being as herein-defined; and comprising

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



Scheme C-1

wherein

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T, being as herein-defined;
- U represents a leaving group such as a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulphenyl, a C_1-C_6 haloalkylsulphenyl ; a substituted or non-substitued phenylsulphenyl a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substitued phenylsulfonate, and that comprises

reacting an amino derivative of formula (XIII) with a compound of formula (XIV) in order to yield a compound of formula (VI), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-

(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine, optionally in the presence of an organo-metallic reagent such as an organo-lithium reagent for example *n*-butyl lithium, methyl lithium, phenyl lithium or an organo-magnesium halide reagent (Grignard reagent) such as isopropyl magnesium halide for example isopropyl magnesium chloride, optionally in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithiium diisopropylamide, 2,2,6,6-tetramethylpiperidylmagnesium chloride, lithium hexamethyldisilazide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of a metallic salt such as an alkaline earth metal salt, an alkali metal salt, a transition metal salt such as a lithium salt, preferably a lithium halide, more preferably lithium chloride, such as a copper salt, preferably a copper(I) salt such as copper(I) chloride, copper(I) cyanide, in the presence of an oxidative agent such as oxygen, 3,3',5,5'-tetra-tert-butyldiphenoquinone, 2,3-dichloro-5,6-dicyano-1,4-benzoquinone (DDQ), and 2,3,5,6-tetrachloro-1,4-benzoquinone (chloranil).

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

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

composition according to the invention. This amount can be determined by systematic field trials, which are within the capabilities of a person skilled in the art.

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

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

The composition according to the invention may also comprise additional components. In particular, the composition may further comprise a surfactant. The surfactant can be an emulsifier, a dispersing agent or a wetting agent of ionic or non-ionic type or a mixture of such surfactants. Mention may be made, for example, of polyacrylic acid salts, lignosulphonic acid salts, phenolsulphonic or naphthalenesulphonic acid salts, polycondensates of ethylene oxide with fatty alcohols or with fatty acids or with fatty amines, substituted phenols (in particular alkylphenols or arylphenols), salts of sulphosuccinic acid esters, taurine derivatives (in particular alkyl taurates), phosphoric esters of polyoxyethylated alcohols or phenols, fatty acid esters of polyols, and derivatives of the above compounds containing sulphate, sulphonate and phosphate functions. The presence of at least one surfactant is generally essential when the active compound and/or the inert support are water-insoluble and when the vector agent for the application is water. Preferably, surfactant content may be comprised from 5% to 40% by weight of the composition.

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

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

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

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

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

(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, 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 (mixture of syn-epimeric racemate 1RS,4SR,9RS and anti-epimeric racemate 1RS,4SR,9SR),

isopyrazam (syn epimeric racemate 1RS,4SR,9RS), isopyrazam (syn-epimeric enantiomer 1R,4S,9R), isopyrazam (syn-epimeric enantiomer 1S,4R,9S), isopyrazam (anti-epimeric racemate 1RS,4SR,9SR), isopyrazam (anti-epimeric enantiomer 1R,4S,9S), isopyrazam (anti-epimeric enantiomer 1S,4R,9R), mepronil, oxycarboxin, penflufen, penthiopyrad, sedaxane, thifluzamide as CII-respiration inhibitor; amisulbrom, azoxystrobin, cyazofamid, dimoxystrobin, enestroburin, famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyraoxystrobin, pyrametostrobin, 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, blasticidin-S, cyprodinil, kasugamycin, kasugamycin hydrochloride hydrate, mepanipyrim and pyrimethanil.

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

(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, pyrifenox, quinconazole, simeconazole, spiroxamine, tebuconazole, terbinafine, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, tridemorph, triflumizole, triforine, triticonazole, uniconazole, uniconazole-p, viniconazole and voriconazole.

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

(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, fluorofolpet, folpet, guazatine, guazatine acetate, iminoctadine, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, mancopper, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, oxine-copper, propamidine, propineb, sulphur and sulphur preparations including calcium polysulphide, thiram, tolylfluanid, 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, 3-(difluoromethyl)-1-methyl-N-(3',4',5'-trifluorobiphenyl-2-yl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, 3-(difluoromethyl)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxy)phenyl]-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]-N^2-(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), tebufloquin, 5-methyl-6-octyl-3,7-dihydro[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, 5-ethyl-6-octyl-3,7-dihydro[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, ametoctradin, 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, flutianil, fosetyl-aluminium, fosetyl-calcium, fosetyl-sodium, hexachlorobenzene, irumamycin, isotianil, methasulfocarb, methyl (2E)-2-{2-[({cyclopropyl[(4-methoxyphenyl)imino]methyl}thio)methyl]phenyl}-3-methoxyacrylate, methyl isothiocyanate, metrafenone, (5-chloro-2-methoxy-4-methylpyridin-3-yl)(2,3,4-trimethoxy-6-methylphenyl)methanone, mildiomycin, tolnifanide, N-(4-chlorobenzyl)-3-[3-methoxy-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamide, N-[(4-chlorophenyl)(cyano)methyl]-3-[3-methoxy-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamide, N-[(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl]-2,4-dichloropyridine-3-carboxamide, N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloropyridine-3-carboxamide, N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2-fluoro-4-iodopyridine-3-carboxamide, N-{(Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl}-2-phenylacetamide, N-{(E)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl}-2-phenylacetamide, natamycin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothal-isopropyl, octhilinone, oxamocarb, oxyfenthiin, pentachlorophenol and salts, phenazine-1-carboxylic acid, phenothrin, phosphorous acid and its salts, propamocarb fosetylate, 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-N'-phenyl-N'-prop-2-yn-1-ylthiophene-2-sulfonohydrazide, zarilamid, N-methyl-2-(1-{[5-

methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazole-4-carboxamide, N-methyl-2-(1-{[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl}piperidin-4-yl)-N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,3-thiazole-4-carboxamide, 3-(difluoromethyl)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxy)phenyl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide and pentyl {6-[({[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylidene]amino}oxy)methyl]pyridin-2-yl}carbamate.

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

The compounds of formula (I) and the fungicide composition according to the invention can be used to curatively or preventively control the phytopathogenic fungi of plants or crops.
Thus, according to a further aspect of the invention, there is provided a method for curatively or preventively controlling the phytopathogenic fungi of plants or crops characterised in that a compound of formula (I) or a fungicide composition according to the invention is applied to the seed, the plant or to the fruit of the plant or to the soil wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.
The method of treatment according to the invention may also be useful to treat propagation material such as tubers or rhizomes, but also seeds, seedlings or seedlings pricking out and plants or plants pricking out. This method of treatment can also be useful to treat roots. The method of treatment according to the invention can also be useful to treat the over ground parts of the plant such as trunks, stems or stalks, leaves, flowers and fruit of the concerned plant.

Among the plants that can be protected by the method according to the invention, mention may be made of cotton ; flax ; vine ; fruit or vegetable crops such as *Rosaceae sp.* (for instance pip fruit such as apples and pears, but also stone fruit such as apricots, almonds and peaches), *Ribesioidae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (for instance banana trees and plantins), *Rubiaceae sp.*, *Theaceae sp.*, *Sterculiceae 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, rice, barley and triticale), *Asteraceae sp.* (for instance sunflower), *Cruciferae sp.* (for instance colza), Fabacae sp. (for instance peanuts), Papilionaceae sp. (for instance soybean), *Solanaceae sp.* (for instance potatoes), *Chenopodiaceae sp.* (for instance beetroots) ; horticultural and forest crops ; as well as genetically modified homologues of these crops.

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

- Powdery Mildew Diseases such as
  Blumeria diseases caused for example by Blumeria graminis;
  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 meibomiae;
  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
  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;
  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;
- 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;

Cladiosporium diseases caused for example by Cladiosporium cucumerinum;
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;
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;
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;
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;
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;

- 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 Cladiosporium cladosporioides;
Claviceps diseases caused for example by Claviceps purpurea;
Fusarium diseases caused for example by Fusarium culmorum;
Gibberella diseases caused for example by Gibberella zeae;
Monographella diseases caused for example by Monographella nivalis;

- Smut- and Bunt Diseases such as

Sphacelotheca diseases caused for example by Sphacelotheca reiliana;
Tilletia diseases caused for example by Tilletia caries;
Urocystis diseases caused for example by Urocystis occulta;
Ustilago diseases caused for example by Ustilago nuda;

- Fruit Rot and Mould Diseases such as

Aspergillus diseases caused for example by Aspergillus flavus;
Botrytis diseases caused for example by Botrytis cinerea;
Penicillium diseases caused for example by Penicillium expansum and Penicillium 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;

- 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;
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;
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;
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;
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;
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;
- 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;
  Rigidoporus diseases caused for example by Rigidoporus lignosus
- 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;
  Helminthosporium diseases caused for example by Helminthosporium solani;
- Club root diseases such as
  Plasmodiophora diseases, cause for example by Plamodiophora brassicae.
- 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.

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

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

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 method of treatment according to the invention can be used in the treatment of genetically modified organisms (GMOs), e.g. plants or seeds. Genetically modified plants (or transgenic plants) are plants in which a heterologous gene has been stably integrated into the genome. The expression "heterologous gene" essentially means a gene which is provided or assembled outside the plant and when introduced in the nuclear, chloroplastic or mitochondrial genome gives the transformed plant new or improved agronomic or other properties by expressing a protein or polypeptide of interest or by downregulating or silencing other gene(s) which are present in the plant (using for example, antisense technology, co suppression technology or RNA interference – RNAi - technology). A heterologous gene that is located in the genome is also called a transgene. A transgene that is defined by its particular location in the plant genome is called a transformation or transgenic event.

Depending on the plant species or plant cultivars, their location and growth conditions (soils, climate, vegetation period, diet), the treatment according to the invention may also result in superadditive ("synergistic") effects. Thus, for example, reduced application rates and/or a widening of the activity spectrum and/or an increase in the activity of the active compounds and compositions which can be used according to the invention, better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, bigger fruits, larger plant height, greener leaf color, earlier flowering, higher quality

and/or a higher nutritional value of the harvested products, higher sugar concentration within the fruits, better storage stability and/or processability of the harvested products are possible, which exceed the effects which were actually to be expected.

At certain application rates, the active compound combinations according to the invention may also have a strengthening effect in plants. Accordingly, they are also suitable for mobilizing the defense system of the plant against attack by unwanted phytopathogenic fungi and/ or microorganisms and/or viruses. This may, if appropriate, be one of the reasons of the enhanced activity of the combinations according to the invention, for example against fungi. Plant-strengthening (resistance-inducing) substances are to be understood as meaning, in the present context, those substances or combinations of substances which are capable of stimulating the defense system of plants in such a way that, when subsequently inoculated with unwanted phytopathogenic fungi and/ or microorganisms and/or viruses, the treated plants display a substantial degree of resistance to these unwanted phytopathogenic fungi and/ or microorganisms and/or viruses. In the present case, unwanted phytopathogenic fungi and/ or microorganisms and/or viruses are to be understood as meaning phytopathogenic fungi, bacteria and viruses. Thus, the substances according to the invention can be employed for protecting plants against attack by the abovementioned pathogens within a certain period of time after the treatment. The period of time within which protection is effected generally extends from 1 to 10 days, preferably 1 to 7 days, after the treatment of the plants with the active compounds.

Plants and plant cultivars which are preferably to be treated according to the invention include all plants which have genetic material which impart particularly advantageous, useful traits to these plants (whether obtained by breeding and/or biotechnological means).

Plants and plant cultivars which are also preferably to be treated according to the invention are resistant against one or more biotic stresses, i.e. said plants show a better defense against animal and microbial pests, such as against nematodes, insects, mites, phytopathogenic fungi, bacteria, viruses and/or viroids.

Plants and plant cultivars which may also be treated according to the invention are those plants which are resistant to one or more abiotic stresses. Abiotic stress conditions may include, for example, drought, cold temperature exposure, heat exposure, osmotic stress, flooding, increased soil salinity, increased mineral exposure, ozon exposure, high light exposure, limited availability of nitrogen nutrients, limited availability of phosphorus nutrients, shade avoidance.

Plants and plant cultivars which may also be treated according to the invention, are those plants characterized by enhanced yield characteristics. Increased yield in said plants can be the result of, for example, improved plant physiology, growth and development, such as water use efficiency, water retention efficiency, improved nitrogen use, enhanced carbon assimilation, improved photosynthesis, increased germination efficiency and accelerated maturation. Yield can furthermore be affected by improved plant architecture (under stress and non-stress conditions), including but not limited to, early flowering, flowering control for hybrid seed production, seedling vigor, plant size, internode number and distance, root growth, seed size, fruit size, pod size, pod or ear number, seed number per pod or ear, seed mass, enhanced seed filling, reduced seed dispersal, reduced pod dehiscence and lodging resistance. Further yield traits include seed composition, such as carbohydrate content, protein content, oil content and composition, nutritional value, reduction in anti-nutritional compounds, improved processability and better storage stability.

Plants that may be treated according to the invention are hybrid plants that already express the characteristic of heterosis or hybrid vigor which results in generally higher yield, vigor, health and resistance towards biotic and abiotic stress factors. Such plants are typically made by crossing an inbred male-sterile parent line (the female parent) with another inbred male-fertile parent line (the male parent). Hybrid seed is typically harvested from the male sterile plants and sold to growers. Male sterile plants can sometimes (e.g. in corn) be produced by detasseling, i.e. the mechanical removal of the male reproductive organs (or males flowers) but, more typically, male sterility is the result of genetic determinants in the plant genome. In that case, and especially when seed is the desired product to be harvested from the hybrid plants it is typically useful to ensure that male fertility in the hybrid plants is fully restored. This can be accomplished by ensuring that the male parents have appropriate fertility restorer genes which are capable of restoring the male fertility in hybrid plants that contain the genetic determinants responsible for male-sterility. Genetic determinants for male sterility may be located in the cytoplasm. Examples of cytoplasmic male sterility (CMS) were for instance described in Brassica species (WO 1992/005251, WO 1995/009910, WO 1998/27806, WO 2005/002324, WO 2006/021972 and US 6,229,072). However, genetic determinants for male sterility can also be located in the nuclear genome. Male sterile plants can also be obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering. A particularly useful means of obtaining male-sterile plants is described in WO 1989/10396 in which, for example, a ribonuclease such as barnase is selectively expressed in the tapetum cells in the stamens. Fertility can then be restored by expression in the tapetum cells of a ribonuclease inhibitor such as barstar (e.g. WO 1991/002069).

Plants or plant cultivars (obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering) which may be treated according to the invention are herbicide-tolerant plants, i.e. plants made tolerant to one or more given herbicides. Such plants can be obtained either by genetic transformation, or by selection of plants containing a mutation imparting such herbicide tolerance.

Herbicide-tolerant plants are for example glyphosate-tolerant plants, i.e. plants made tolerant to the herbicide glyphosate or salts thereof. Plants can be made tolerant to glyphosate through different means. For example, glyphosate-tolerant plants can be obtained by transforming the plant with a gene encoding the enzyme 5-enolpyruvylshikimate-3-phosphate synthase (EPSPS). Examples of such EPSPS genes are the AroA gene (mutant CT7) of the bacterium *Salmonella typhimurium* (Comai et al., Science (1983), 221, 370-371), the CP4 gene of the bacterium *Agrobacterium sp.* (Barry et al., Curr. Topics Plant Physiol. (1992), 7, 139-145), the genes encoding a Petunia EPSPS (Shah et al., Science (1986), 233, 478-481), a Tomato EPSPS (Gasser et al., J. Biol. Chem. (1988),263, 4280-4289), or an Eleusine EPSPS (WO 2001/66704). It can also be a mutated EPSPS as described in for example EP-A 0837944, WO 2000/066746, WO 2000/066747 or WO 2002/026995. Glyphosate-tolerant plants can also be obtained by expressing a gene that encodes a glyphosate oxido-reductase enzyme as described in US 5,776,760 and US 5,463,175. Glyphosate-tolerant plants can also be obtained by expressing a gene that encodes a glyphosate acetyl transferase enzyme as described in for example WO 2002/036782, WO 2003/092360, WO 2005/012515 and WO 2007/024782. Glyphosate-tolerant plants can also be obtained by selecting plants containing naturally-occurring mutations of the above-mentioned genes, as described in for example WO 2001/024615 or WO 2003/013226.

Other herbicide resistant plants are for example plants that are made tolerant to herbicides inhibiting the enzyme glutamine synthase, such as bialaphos, phosphinothricin or glufosinate. Such plants can be obtained by expressing an enzyme detoxifying the herbicide or a mutant glutamine synthase enzyme that is resistant to inhibition. One such efficient detoxifying enzyme is an enzyme encoding a phosphinothricin acetyltransferase (such as the bar or pat protein from Streptomyces species). Plants expressing an exogenous phosphinothricin acetyltransferase are for example described in US 5,561,236; US 5,648,477; US 5,646,024; US 5,273,894; US 5,637,489; US 5,276,268; US 5,739,082; US 5,908,810 and US 7,112,665.

Further herbicide-tolerant plants are also plants that are made tolerant to the herbicides inhibiting the enzyme hydroxyphenylpyruvatedioxygenase (HPPD). Hydroxyphenylpyruvatedioxygenases are enzymes that catalyze the reaction in which para-hydroxyphenylpyruvate (HPP) is transformed into homogentisate. Plants tolerant to HPPD-

inhibitors can be transformed with a gene encoding a naturally-occurring resistant HPPD enzyme, or a gene encoding a mutated HPPD enzyme as described in WO 1996/038567, WO 1999/024585 and WO 1999/024586. Tolerance to HPPD-inhibitors can also be obtained by transforming plants with genes encoding certain enzymes enabling the formation of homogentisate despite the inhibition of the native HPPD enzyme by the HPPD-inhibitor. Such plants and genes are described in WO 1999/034008 and WO 2002/36787. Tolerance of plants to HPPD inhibitors can also be improved by transforming plants with a gene encoding an enzyme prephenate dehydrogenase in addition to a gene encoding an HPPD-tolerant enzyme, as described in WO 2004/024928.

Still further herbicide resistant plants are plants that are made tolerant to acetolactate synthase (ALS) inhibitors. Known ALS-inhibitors include, for example, sulfonylurea, imidazolinone, triazolopyrimidines, pyrimidinyloxy(thio)benzoates, and/or sulfonylaminocarbonyltriazolinone herbicides. Different mutations in the ALS enzyme (also known as acetohydroxyacid synthase, AHAS) are known to confer tolerance to different herbicides and groups of herbicides, as described for example in Tranel and Wright, Weed Science (2002), 50, 700-712, but also, in US 5,605,011, US 5,378,824, US 5,141,870, and US 5,013,659. The production of sulfonylurea-tolerant plants and imidazolinone-tolerant plants is described in US 5,605,011; US 5,013,659; US 5,141,870; US 5,767,361; US 5,731,180; US 5,304,732; US 4,761,373; US 5,331,107; US 5,928,937; and US 5,378,824; and international publication WO 1996/033270. Other imidazolinone-tolerant plants are also described in for example WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351, and WO 2006/060634. Further sulfonylurea- and imidazolinone-tolerant plants are also described in for example WO 2007/024782.

Other plants tolerant to imidazolinone and/or sulfonylurea can be obtained by induced mutagenesis, selection in cell cultures in the presence of the herbicide or mutation breeding as described for example for soybeans in US 5,084,082, for rice in WO 1997/41218, for sugar beet in US 5,773,702 and WO 1999/057965 , for lettuce in US 5,198,599, or for sunflower in WO 2001/065922.

Plants or plant cultivars (obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering) which may also be treated according to the invention are insect-resistant transgenic plants, i.e. plants made resistant to attack by certain target insects. Such plants can be obtained by genetic transformation, or by selection of plants containing a mutation imparting such insect resistance.

An "insect-resistant transgenic plant", as used herein, includes any plant containing at least one transgene comprising a coding sequence encoding:

1) an insecticidal crystal protein from *Bacillus thuringiensis* or an insecticidal portion thereof, such as the insecticidal crystal proteins listed by Crickmore et al., Microbiology and Molecular Biology Reviews (1998), 62, 807-813, updated by Crickmore et al. (2005) at the *Bacillus thuringiensis* toxin nomenclature, online at: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), or insecticidal portions thereof, e.g., proteins of the Cry protein classes Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, or Cry3Bb or insecticidal portions thereof; or

2) a crystal protein from *Bacillus thuringiensis* or a portion thereof which is insecticidal in the presence of a second other crystal protein from *Bacillus thuringiensis* or a portion thereof, such as the binary toxin made up of the Cry34 and Cry35 crystal proteins (Moellenbeck et al., Nat. Biotechnol. (2001), 19, 668-72; Schnepf et al., Applied Environm. Microbiol. (2006), 71, 1765-1774); or

3) a hybrid insecticidal protein comprising parts of different insecticidal crystal proteins from *Bacillus thuringiensis*, such as a hybrid of the proteins of 1) above or a hybrid of the proteins of 2) above, e.g., the Cry1A.105 protein produced by corn event MON98034 (WO 2007/027777); or

4) a protein of any one of 1) to 3) above wherein some, particularly 1 to 10, amino acids have been replaced by another amino acid to obtain a higher insecticidal activity to a target insect species, and/or to expand the range of target insect species affected, and/or because of changes introduced into the encoding DNA during cloning or transformation, such as the Cry3Bb1 protein in corn events MON863 or MON88017, or the Cry3A protein in corn event MIR604;

5) an insecticidal secreted protein from *Bacillus thuringiensis* or *Bacillus cereus*, or an insecticidal portion thereof, such as the vegetative insecticidal (VIP) proteins listed at: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, e.g., proteins from the VIP3Aa protein class; or

6) a secreted protein from *Bacillus thuringiensis* or *Bacillus cereus* which is insecticidal in the presence of a second secreted protein from *Bacillus thuringiensis* or *B. cereus*, such as the binary toxin made up of the VIP1A and VIP2A proteins (WO 1994/21795); or

7) a hybrid insecticidal protein comprising parts from different secreted proteins from *Bacillus thuringiensis* or *Bacillus cereus*, such as a hybrid of the proteins in 1) above or a hybrid of the proteins in 2) above; or

8) a protein of any one of 1) to 3) above wherein some, particularly 1 to 10, amino acids have been replaced by another amino acid to obtain a higher insecticidal activity to a

target insect species, and/or to expand the range of target insect species affected, and/or because of changes introduced into the encoding DNA during cloning or transformation (while still encoding an insecticidal protein), such as the VIP3Aa protein in cotton event COT102.

Of course, an insect-resistant transgenic plant, as used herein, also includes any plant comprising a combination of genes encoding the proteins of any one of the above classes 1 to 8. In one embodiment, an insect-resistant plant contains more than one transgene encoding a protein of any one of the above classes 1 to 8, to expand the range of target insect species affected when using different proteins directed at different target insect species, or to delay insect resistance development to the plants by using different proteins insecticidal to the same target insect species but having a different mode of action, such as binding to different receptor binding sites in the insect.

Plants or plant cultivars (obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering) which may also be treated according to the invention are tolerant to abiotic stresses. Such plants can be obtained by genetic transformation, or by selection of plants containing a mutation imparting such stress resistance. Particularly useful stress tolerance plants include:

a. plants which contain a transgene capable of reducing the expression and/or the activity of poly(ADP-ribose)polymerase (PARP) gene in the plant cells or plants as described in WO 2000/004173 or WO2006/045633 or PCT/EP07/004142.

b. plants which contain a stress tolerance enhancing transgene capable of reducing the expression and/or the activity of the PARG encoding genes of the plants or plants cells, as described e.g. in WO 2004/090140.

c. plants which contain a stress tolerance enhancing transgene coding for a plant-functional enzyme of the nicotinamide adenine dinucleotide salvage synthesis pathway including nicotinamidase, nicotinate phosphoribosyltransferase, nicotinic acid mononucleotide adenyl transferase, nicotinamide adenine dinucleotide synthetase or nicotine amide phosphoribosyltransferase as described e.g. in WO2006/032469 or WO 2006/133827 or PCT/EP07/002433.

Plants or plant cultivars (obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering) which may also be treated according to the invention show altered quantity, quality and/or storage-stability of the harvested product and/or altered properties of specific ingredients of the harvested product such as :

1) transgenic plants which synthesize a modified starch, which in its physical-chemical characteristics, in particular the amylose content or the amylose/amylopectin ratio, the degree of branching, the average chain length, the side chain distribution, the viscosity behaviour, the gelling strength, the starch grain size and/or the starch grain morphology, is changed in comparison with the synthesised starch in wild type plant cells or plants, so that this is better suited for special applications. Said transgenic plants synthesizing a modified starch are disclosed, for example, in EP 0571427, WO 1995/004826, EP 0719338, WO 1996/15248, WO 1996/19581, WO 1996/27674, WO 1997/11188, WO 1997/26362, WO 1997/32985, WO 1997/42328, WO 1997/44472, WO 1997/45545, WO 1998/27212, WO 1998/40503, WO99/58688, WO 1999/58690, WO 1999/58654, WO 2000/008184, WO 2000/008185, WO 2000/008175, WO 2000/28052, WO 2000/77229, WO 2001/12782, WO 2001/12826, WO 2002/101059, WO 2003/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 2000/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 2002/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP 07090007.1, EP 07090009.7, WO 2001/14569, WO 2002/79410, WO 2003/33540, WO 2004/078983, WO 2001/19975, WO 1995/26407, WO 1996/34968, WO 1998/20145, WO 1999/12950, WO 1999/66050, WO 1999/53072, US 6,734,341, WO 2000/11192, WO 1998/22604, WO 1998/32326, WO 2001/98509, WO 2001/98509, WO 2005/002359, US 5,824,790, US 6,013,861, WO 1994/004693, WO 1994/009144, WO 1994/11520, WO 1995/35026, WO 1997/20936.

2) transgenic plants which synthesize non starch carbohydrate polymers or which synthesize non starch carbohydrate polymers with altered properties in comparison to wild type plants without genetic modification. Examples are plants producing polyfructose, especially of the inulin and levan-type, as disclosed in EP 0663956, WO 1996/001904, WO 1996/021023, WO 1998/039460, and WO 1999/024593, plants producing alpha 1,4 glucans as disclosed in WO 1995/031553, US 2002/031826, US 6,284,479, US 5,712,107, WO 1997/047806, WO 1997/047807, WO 1997/047808 and WO 2000/014249, plants producing alpha-1,6 branched alpha-1,4-glucans, as disclosed

in WO 2000/73422, plants producing alternan, as disclosed in WO 2000/047727, EP 06077301.7, US 5,908,975 and EP 0728213,

3) transgenic plants which produce hyaluronan, as for example disclosed in WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006/304779, and WO 2005/012529.

Plants or plant cultivars (that can be obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering) which may also be treated according to the invention are plants, such as cotton plants, with altered fiber characteristics. Such plants can be obtained by genetic transformation, or by selection of plants contain a mutation imparting such altered fiber characteristics and include:

a) Plants, such as cotton plants, containing an altered form of cellulose synthase genes as described in WO 1998/000549
b) Plants, such as cotton plants, containing an altered form of rsw2 or rsw3 homologous nucleic acids as described in WO2004/053219
c) Plants, such as cotton plants, with increased expression of sucrose phosphate synthase as described in WO 2001/017333
d) Plants, such as cotton plants, with increased expression of sucrose synthase as described in WO02/45485
e) Plants, such as cotton plants, wherein the timing of the plasmodesmatal gating at the basis of the fiber cell is altered, e.g. through downregulation of fiberselective β 1,3-glucanase as described in WO2005/017157
f) Plants, such as cotton plants, having fibers with altered reactivity, e.g. through the expression of N-acteylglucosaminetransferase gene including nodC and chitinsynthase genes as described in WO2006/136351

Plants or plant cultivars (that can be obtained by plant biotechnology methods such as genetic engineering) which may also be treated according to the invention are plants, such as oilseed rape or related Brassica plants, with altered oil profile characteristics. Such plants can be obtained by genetic transformation or by selection of plants contain a mutation imparting such altered oil characteristics and include:

a) Plants, such as oilseed rape plants, producing oil having a high oleic acid content as described e.g. in US 5,969,169, US 5,840,946 or US 6,323,392 or US 6,063,947
b) Plants such as oilseed rape plants, producing oil having a low linolenic acid content as described in US 6,270828, US 6,169,190 or US 5,965,755

c) Plant such as oilseed rape plants, producing oil having a low level of saturated fatty acids as described e.g. in US 5,434,283

Particularly useful transgenic plants which may be treated according to the invention are plants which comprise one or more genes which encode one or more toxins, such as the following which are sold under the trade names YIELD GARD$_3$ (for example maize, cotton, soya beans), KnockOut$_3$ (for example maize), BiteGard$_3$ (for example maize), Bt-Xtra$_3$ (for example maize), StarLink$_3$ (for example maize), Bollgard$_3$ (cotton), Nucotn$_3$ (cotton), Nucotn 33B®(cotton), NatureGard$_3$ (for example maize), Protecta$_3$ and NewLeaf$_3$ (potato). Examples of herbicide-tolerant plants which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties and soya bean varieties which are sold under the trade names Roundup Ready$_3$ (tolerance to glyphosate, for example maize, cotton, soya bean), Liberty Link$_3$ (tolerance to phosphinotricin, for example oilseed rape), IMI$_3$ (tolerance to imidazolinones) and STS$_3$ (tolerance to sulphonylureas, for example maize). Herbicide-resistant plants (plants bred in a conventional manner for herbicide tolerance) which may be mentioned include the varieties sold under the name Clearfield$_3$ (for example maize).

Particularly useful transgenic plants which may be treated according to the invention are plants containing transformation events, or combination of transformation events, that are listed for example in the databases from various national or regional regulatory agencies (see for example http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx and http://www.agbios.com/dbase.php).

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

Furthermore compounds according to the invention may also be used to reduce the contents of mycotoxins in plants and the harvested plant material and therefore in foods and animal feed stuff made therefrom.
Method of combating phytopathogenic and mycotoxin producing fungi characterized in that compounds according to the invention are applied to these fungi and/or their habitat.

Especially but not exclusively the following mycotoxins can be specified:

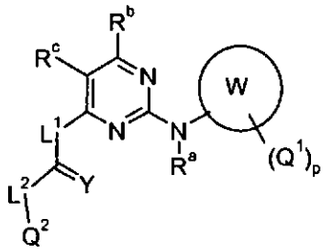
Deoxynivalenole (DON), Nivalenole, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, T2- und HT2- Toxins, Fumonisines, Zearalenone Moniliformine, Fusarine, Diaceotoxyscirpenole (DAS), Beauvericine, Enniatine, Fusaroproliferine, Fusarenole, Ochratoxines, Patuline, Ergotalkaloides und Aflatoxines, which are caused for example by the following fungal diseases: *Fusarium spec.*, like *Fusarium acuminatum, F. avenaceum, F. crookwellense, F. culmorum, F. graminearum (Gibberella zeae), F. equiseti, F. fujikoroi, F. musarum, F. oxysporum, F. proliferatum, F. poae, F. pseudograminearum, F. sambucinum, F. scirpi, F. semitectum, F. solani, F. sporotrichoides, F. langsethiae, F. subglutinans, F. tricinctum, F. verticillioides* and others but also by *Aspergillus spec.*, *Penicillium spec.*, *Claviceps purpurea, Stachybotrys spec.* and others.

The various aspects of the invention will now be illustrated with reference to the following tables I, II and III of compound examples and the following preparation or efficacy examples.

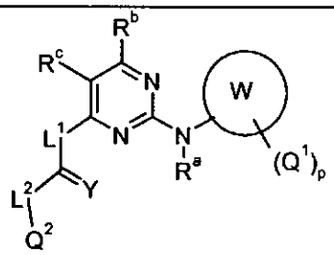
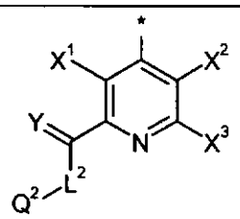
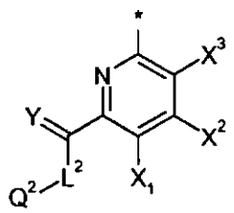
The following tables I, II and III illustrate in a non-limiting manner examples of compounds according to the invention.

In the following tables, 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 (ApcI+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy.

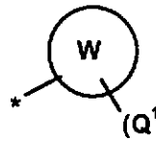
Table I:



Formula (III_2)

 Formula (III_2)	**In Table I** we use the following abbreviations for *-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2:
	*-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2 / **Abbreviation**
Whereas W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different	 L1A
	 L1B

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y		X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	R^c	Measured MW	log p
A1	L1A	oxy	ethyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	H	351	1.1
A2	L1A	bond	3,6-dihydropyridin-1(2H)-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	393	2.2
A3	L1A	bond	3,6-dihydropyridin-1(2H)-yl	oxo	2-(3,6-dihydropyridin-1(2H)-ylcarbonyl)pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	468	1.6
A4	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	2-[(2-methoxyethyl)(methyl)carbamoyl] pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	480	1.1
A5	L1A	bond	piperidin-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	395	2.23
A6	L1A	bond	piperidin-1-yl	oxo	2-(piperidin-1-ylcarbonyl)pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	472	1.63
A7	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	381	2.08
A8	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	2-(pyrrolidin-1-ylcarbonyl)pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	444	1.37
A9	L1A	bond	3-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	425	1.69
A10	L1A	propylimino	2-hydroxyethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	413	1.84
A11	L1A	propylimino	propyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	411	2,88[c]
A12	L1A	propylimino	propyl	oxo	2-(dipropylcarbamoyl)pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	504	2.54
A13	L1A	methylimino	propyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	383	2.2
A14	L1A	methylimino	propyl	oxo	2-[methyl(propyl)carbamoyl]pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	448	1.59
A15	L1A	methylimino	tetrahydrofuran-2-ylmethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	425	1.99

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y		X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	R^c	Measured MW	log p
A16	L1A	methylimino	tetrahydrofuran-2-ylmethyl	oxo	2-[methyl(tetrahydrofuran-2-ylmethyl)carbamoyl]pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	532	1.35
A17	L1A	methylimino	ethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	369	1.91
A18	L1A	methylimino	ethyl	oxo	2-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	403	2.22
A19	L1A	methylimino	ethyl	oxo	2-[ethyl(methyl)carbamoyl]pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	420	1.19
A20	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	480	2.33
A21	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl	oxo	2-{[3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl]carbamoyl}pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	642	2.33
A22	L1A	bond	morpholin-4-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	397	1.69
A23	L1A	bond	morpholin-4-yl	oxo	2-(morpholin-4-ylcarbonyl)pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	476	0.92
A24	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	394	1.78
A25	L1A	methylimino	prop-2-en-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	381	2.13
A26	L1A	ethylimino	propyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	397	2.51
A27	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	383	2.17
A28	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	383	2.13
A29	L1A	methylimino	butan-2-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	397	2.47
A30	L1A	methylimino	3-methylbut-2-en-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	409	2.66
A31	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	395	2.28
A32	L1A	methylimino	methyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	355	1.69
A33	L1B	ethylimino	ethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	383	2.6
A34	L1B	methylimino	methyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	355	1,96[b]
A35	L1B	bond	azetidin-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	367	2,21[b]

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y		X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	R^c	Measured MW	log p
A36	L1B	methylimino	ethyl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	H	369	2,25[b]
A37	L1A	methylimino	ethyl	oxo	4-methylthiophen-2-yl	H	H	H	H	H	H	354	2.43
A38	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	H	354	2.55
A39	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	5-tert-butylthiophen-2-yl	H	H	H	H	H	H	410	3.62
A40	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	5-(4-fluorophenyl)thiophen-2-yl	H	H	H	H	H	H	448	3.71
A41	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	CH_3	368	2.61
A45	L1A	methylimino	3-methylbut-2-en-1-yl	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	R^{a1}	H	H	481	2.49
A46	L1A	methylimino	ethyl	oxo	4,5-dimethylthiophen-2-yl	H	H	H	H	H	H	368	2.68
A47	L1A	methylimino	ethyl	oxo	5-methylthiophen-2-yl	H	H	H	H	H	H	354	2.39
A48	L1A	methylimino	CH_3	oxo	5-methylthiophen-2-yl	H	H	H	H	H	H	340	2.13

Abbreviations: R^{a1} = methoxyacetyl;

Measurement of logP values was performed according EEC directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) on reversed phase columns with the following methods:

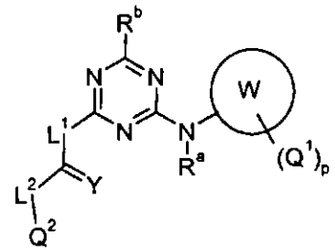
Usually measurement of LC-MS was done at pH 2,7 with 0,1 % formic acid in water and with acetonitrile (contains 0,1% formic acid) as eluent with a linear gradient from 10 % acetonitrle to 95 % acetonitrile.

[b] Measurement was done at pH 2.3 with 0,1% phosphoric acid and acetonitrile as eluent.

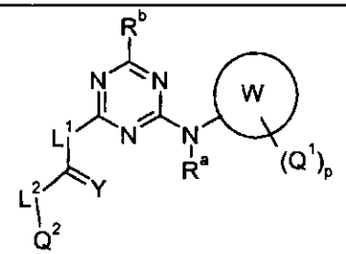
[c] Measurement with LC-MS was done at pH 7.8 with 0,001 molar ammonium hydrogen carbonate solution in water as eluent with a linear gradient from 10 % acetonitrile to 95 % acetonitrile.

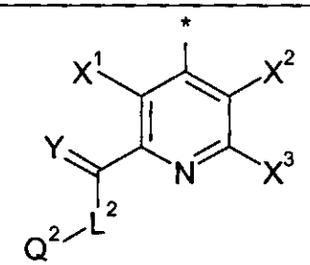
Calibration was done with not branched alkan2-ones (with 3 to 16 carbon atoms) with known logP-values (measurement of logP values using retention times with linear interpolation between successive alkanones).. lambda-maX-values were determined using UV-spectra from 200 nm to 400 nm and the peak values of the chromatographic signals.

Table II:



Formula (II)

 Formula (II) Whereas W represents phenyl	In **table II** we use the same abbreviations for *-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2 as in table I.

*-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2	Abbreviation
	L1A

If $W(Q^1)_p$ = subst. Phenyl, then the position of $(Q^1)_p$ is as shown:

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	(Q^{11})	(Q^{12})	(Q^{13})	(Q^{14})	(Q^{15})	R_a	R_b	X_1	X_2	X_3	Measured MW	log p
B1	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	378	2.22
B2	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	2.72
B3	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	2.72
B4	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2.82
B5	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	339	2.13
B6	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2.92
B7	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	353	2.4
B8	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	2.67
B9	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	2.26
B10	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	2.94
B11	L1A	ethylimino	ethyl	thioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3,31

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^3	R^5	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B12	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	thioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.42
B13	L1A	methylimino	propyl	thioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3.32
B14	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	378	2.14
B15	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	367	2.6
B16	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	367	2.62
B17	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	379	2.73
B18	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	339	2.02
B19	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	381	2.92
B20	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	353	2.28
B21	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	367	2.55
B22	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	383	3.92
B23	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	369	2.8
B24	L1A	methylimino	1-cyclopropyl-2-methoxyethyl	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	423	2.8
B25	L1A	oxy	methyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	342	2.79
B26	L1A	bond	methyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	326	3.32
B27	L1A	bond	methyl	methoxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	4.23
B28	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2.88
B29	L1A	bond	methyl	(prop-2-en-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	4.7
B30	L1A	bond	methyl	(but-3-yn-2-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	4.47
B31	L1A	bond	methyl	ethoxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	4.7

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B32	L1A	bond	methyl	[2-(dimethylamino)ethoxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	1.99
B33	L1A	imino	tetrahydrofuran-2-ylmethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3.09
B34	L1A	bond	methyl	(cyclopropylmethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	4.94
B35	L1A	bond	methyl	(hex-2-yn-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	421	5.16
B36	L1A	bond	methyl	(but-2-yn-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	4.41
B37	L1A	bond	methyl	(prop-2-yn-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	379	3.98
B38	L1A	bond	methyl	(cyclopentyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	5.79
B39	L1A	bond	methyl	[(2,6-dichlorobenzyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	499	6.02
B40	L1A	bond	ethyl	ethoxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	5.1
B41	L1A	bond	ethyl	(prop-2-en-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	5.14
B42	L1A	bond	ethyl	(but-3-yn-2-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	407	4.87
B43	L1A	bond	methyl	propoxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	5.13
B44	L1A	bond	methyl	(2-methylpropoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	5.63
B45	L1A	bond	ethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	340	3.79

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X_1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B46	L1A	bond	ethyl	(hex-2-yn-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	435	5.81
B47	L1A	bond	ethyl	(cyclopentyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	6.39
B48	L1A	bond	methyl	(dicyclopropylmethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	435	5.64
B49	L1A	bond	ethyl	[2-(dimethylamino)ethoxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	426	2.06
B50	L1A	bond	methyl	(benzyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	431	5.18
B51	L1A	imino	1-methoxypropan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3.21
B52	L1A	imino	(2S)-1-methoxypropan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3.39
B53	L1A	bond	ethyl	(but-2-yn-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	407	4.91
B54	L1A	bond	ethyl	(cyclopropylmethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	5.49
B55	L1A	bond	ethyl	propoxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	5.69
B56	L1A	imino	cyclohexyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	4.46
B57	L1A	imino	cyclopropyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	3.05
B58	L1A	bond	ethyl	(2,2,2-trifluoroethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	437	5.39
B59	L1A	imino	2-methoxyethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2.84

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B60	L1A	bond	methyl	[(4-methoxybenzyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	461	4.96
B61	L1A	imino	3-methylbutyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4.3
B62	L1A	imino	3-methylbutan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4.3
B63	L1A	imino	pentan-3-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4.22
B64	L1A	bond	ethyl	hydroxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	3.24
B65	L1A	bond	ethyl	(2-methylpropoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	6.19
B66	L1A	imino	1-(dimethylamino)propan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	1.72
B67	L1A	imino	pentyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4.35
B68	L1A	bond	ethyl	[(4-methoxybenzyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	475	5.46
B69	L1A	bond	ethyl	[(2,6-dichlorobenzyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	513	6.53
B70	L1A	bond	ethyl	[(4-chlorobenzyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	479	6.22
B71	L1A	imino	cyclopentyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	4.03
B72	L1A	bond	ethyl	(benzyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	445	5.65

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B73	L1A	bond	methyl	(2,2,2-trifluoroethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	4.58
B74	L1A	bond	methyl	hydroxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	341	2.8
B75	L1A	bond	methyl	2-methylhydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	354	2.27
B76	L1A	bond	methyl	2-(2,2,2-trifluoroethyl)hydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	422	3.58
B77	L1A	bond	methyl	2-(2-ethoxy-2-oxoethyl)hydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	426	3.02
B78	L1A	bond	amino	hydroxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	342	2.28
B79	L1A	bond	ethyl	(dicyclopropylmethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	449	6.59
B80	L1A	bond	ethyl	(prop-2-yn-1-yloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	4.73
B81	L1A	bond	methyl	2-(2-cyanoethyl)hydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2.5
B82	L1A	bond	methyl	2-(4-chlorophenyl)hydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	450	4.97
B83	L1A	bond	methyl	2-(methoxycarbonyl)hydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	398	2.86

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B84	L1A	bond	ethyl	(1-cyclopropylethoxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	6.24
B85	L1A	bond	ethyl	methoxyimino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	4.81
B86	L1A	imino	1,3-dimethoxypropan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	429	3.39
B87	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	480	3.11
B88	L1A	imino	3-methoxypropyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3.15
B89	L1A	imino	1-methoxybutan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	3.8
B90	L1A	bond	methyl	chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]hydrazinylidene	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	519	5.46
B91	L1A	imino	propan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	3.62
B92	L1A	imino	ethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	3.17
B93	L1A	imino	butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	4.11
B94	L1A	imino	butan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	4.04
B95	L1A	imino	1-cyanobutan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	408	3.35
B96	L1A	imino	4-(2-oxopyrrolidin-1-yl)butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	466	2.73
B97	L1A	imino	4-ethoxycyclohexyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	453	4.39

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B98	L1A	imino	tert-butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	4.39
B99	L1A	imino	cyclopropylmethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3.73
B100	L1A	imino	3-(2-oxopyrrolidin-1-yl)propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	452	2.63
B101	L1A	imino	1,1-dioxidotetrahydrothiophen-3-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	445	2.66
B102	L1A	bond	ethoxy	imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	2.08
B103	L1A	imino	propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	3.62
B104	L1A	bond	amino	[(methoxyacetyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	414	2.92
B105	L1A	imino	2-(morpholin-4-yl)ethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	440	1.68
B106	L1A	bond	amino	(butanoyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	3.8
B107	L1A	bond	amino	[(2-methylpropanoyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	3.69
B108	L1A	bond	amino	(propanoyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	398	3.33
B109	L1A	bond	amino	(acetyloxy)imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	384	2.95
B110	L1A	bond	amino	[(3-methylbutanoyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	426	4.12
B111	L1A	bond	amino	[(3-methylbut-2-enoyl)oxy]imino	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	424	3.92

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B112	L1A	imino	oxetan-3-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	2.6
B113	L1A	imino	cyclobutyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3.89
B114	L1A	imino	1-(diethylamino)propan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	440	1.9
B115	L1A	bond	piperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.1
B116	L1A	bond	morpholin-4-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	2.39
B117	L1A	imino	2,2,2-trifluoroethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.67
B118	L1A	imino	pentan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4.54
B119	L1A	imino	H	thioxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	343	3.12
B120	L1A	bond	4-(trifluoromethyl)piperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	463	3.55
B121	L1A	imino	3,3,3-trifluoropropyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.73
B122	L1A	imino	1-ethylpiperidin-3-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	438	1.82
B123	L1A	methylimino	butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	396	3.48
B124	L1A	propylimino	propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	410	3.89
B125	L1A	ethylimino	propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	396	3.46
B126	L1A	propylimino	butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	4.31
B127	L1A	methylimino	prop-2-en-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2.96
B128	L1A	methylimino	hexyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	4.34
B129	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	394	2.51
B130	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3.06

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B131	L1A	bond	4-methylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.51
B132	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3.06
B133	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.15
B134	L1A	bond	(2R)-2-(methoxymethyl)pyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	3.08
B135	L1A	bond	3-methylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.48
B136	L1A	methylimino	2-hydroxyethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2.04
B137	L1A	bond	2,3-dimethylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.78
B138	L1A	bond	azepan-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.46
B139	L1A	bond	2-ethylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.8
B140	L1A	bond	3-hydroxypiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	2.2
B141	L1A	bond	2,5-dimethylpyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.64
B142	L1A	bond	2-methylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.39

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log P
B143	L1A	prop-2-en-1-ylimino	prop-2-en-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	407	3.67
B144	L1A	methylimino	cyclohexyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.89
B145	L1A	bond	3-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2.3
B146	L1A	methylimino	3-methylbutyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3.87
B147	L1A	bond	3,3-dimethylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.83
B148	L1A	methylimino	3-methylbut-2-en-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.67
B149	L1A	methylimino	cyclopentyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.51
B150	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	2.4
B151	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	3.42
B152	L1A	bond	2-methylpyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.23
B153	L1A	bond	3,6-dihydropyridin-1(2H)-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3.11
B154	L1A	bond	2,6-dimethylmorpholin-4-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2.92
B155	L1A	bond	3,5-dimethylpiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.96

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B156	L1A	ethylimino	2-methylprop-2-en-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.67
B157	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	2.69
B158	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	2.96
B159	L1A	propylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3.94
B160	L1A	methylimino	tetrahydrofuran-2-ylmethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2.76
B161	L1A	methylimino	pentyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3.89
B162	L1A	ethylimino	butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3.87
B163	L1A	bond	4-formylpiperazin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	424	2.04
B164	L1A	ethylimino	2-hydroxyethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2.25
B165	L1A	bond	2-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2.48
B166	L1A	ethylimino	2-hydroxy-2-methylpropyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	427	2.66
B167	L1A	ethylimino	tetrahydrofuran-2-ylmethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	439	3.09
B168	L1A	bond	4-oxoimidazolidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	396	2.15
B169	L1A	bond	4-methoxypiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2.68

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^{1)1}$	$(Q^{1)2}$	$(Q^{1)3}$	$(Q^{1)4}$	$(Q^{1)5}$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B170	L1A	bond	4-cyanopiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	420	2.59
B171	L1A	propylimino	butan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	4.13
B172	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2.57
B173	L1A	bond	4-hydroxypiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	2.04
B174	L1A	hexylimino	hexyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	496	6.69
B175	L1A	butylimino	butyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	439	4.75
B176	L1A	bond	thiomorpholin-4-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	2.98
B177	L1A	bond	3-hydroxypyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	2.07
B178	L1A	imino	3-(formylamino)propyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	394	2.26
B179	L1A	bond	3-methoxypiperidin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	424	2,76[b]
B180	L1A	(2-hydroxyethyl)imino	propan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	2.45
B181	L1A	propylimino	2-hydroxyethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	2,51[b]
B182	L1A	propylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	422	3,13[b]
B183	L1A	imino	3-hydroxypropyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2.4

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B184	L1A	bond	4-methylpiperazin-1-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	410	1.5
B185	L1A	imino	hydroxy	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	343	2.13
B186	L1A	methylimino	methoxy	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	371	2.59
B187	L1A				H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	2.63
B188	L1A	methylimino	1-cyclopropyl-2-methoxyethyl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	480	3,09
B189	L1A	methylimino	3-methoxybutan-2-yl	oxo	H	chloro	H	H	H	H	H	H	H	H	427	3,15
B190	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3
B191	L1A	imino	1-methoxypropan-2-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	417	3.48
B192	L1A	imino	cyclopropyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	385	3.31
B193	L1A	imino	2-methoxyethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	403	3.08
B194	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	498	3.19
B195	L1A	imino	1-methoxybutan-2-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	431	3.89
B196	L1A	imino	propan-2-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	387	3.73
B197	L1A	imino	butan-2-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	4.16
B198	L1A	imino	cyclopropylmethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3.83

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B199	L1A	imino	cyclobutyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3.94
B200	L1A	imino	pentan-2-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	415	4.64
B201	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	412	2,58
B202	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	3,13
B203	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	3,13
B204	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	413	3,23
B205	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	373	2,47
B206	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	415	3,46
B207	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	387	2.75
B208	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	3,02
B209	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	403	3.33
B210	L1A	methylimino	1-cyclopropyl-2-methoxyethyl	oxo	H	chloro	F	H	H	H	H	H	H	H	457	3,33
B211	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2.82
B212	L1A	imino	1-methoxypropan-2-yl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3.31
B213	L1A	imino	cyclopropyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	379	3.15
B214	L1A	imino	2-methoxyethyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	397	2.92
B215	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	492	3.02
B216	L1A	imino	1-methoxybutan-2-yl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	425	3.69
B217	L1A	imino	propan-2-yl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3.53

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B218	L1A	imino	butan-2-yl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.94
B219	L1A	imino	cyclopropylmethyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3.64
B220	L1A	imino	cyclobutyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3.73
B221	L1A	imino	pentan-2-yl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	409	4.44
B222	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2.6
B223	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	397	3.17
B224	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	395	3.26
B225	L1A	imino	1-methoxypropan-2-yl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	413	3.8
B226	L1A	imino	cyclopropyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	381	3.62
B227	L1A	imino	2-methoxyethyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	399	3.48
B228	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	494	3.44
B229	L1A	imino	1-methoxybutan-2-yl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	427	4.24
B230	L1A	imino	propan-2-yl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	383	4.04
B231	L1A	imino	ethyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	369	3.55
B232	L1A	imino	butan-2-yl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	397	4.49
B233	L1A	imino	cyclopropylmethyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	395	4.16
B234	L1A	imino	cyclobutyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	395	4.29
B235	L1A	imino	pentan-2-yl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	411	5
B236	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	chloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	383	3.02

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B237	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	fluoro	H	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	396	2.1
B238	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	fluoro	H	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	399	2.9
B239	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	404	1.94
B240	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2.48
B241	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2.48
B242	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	405	2.58
B243	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	365	1.91
B244	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	407	2.66
B245	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2.17
B246	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,42
B247	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	409	2.05
B248	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	395	2.66
B249	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	thioxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	421	3.12
B250	L1A	methylimino	propyl	thioxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3.05
B251	L1A	methylimino	1-cyclopropyl-2-methoxyethyl	oxo	H	methoxymethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	449	2.69
B252	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	pentafluoro-lambda^6-sulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	461	3.06

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B253	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	pentafluoro-lambda^6-sulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	477	3.57
B254	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	ethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2.6
B255	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	ethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.15
B256	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	trifluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	403	2.86
B257	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	trifluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	419	3.41
B258	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	propan-2-yl	H	H	H	H	H	H	H	H	377	3.11
B259	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	propan-2-yl	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3.7
B260	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	451	2.92
B261	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	467	3.41
B262	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	444	2.8
B263	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3.39
B264	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3.37
B265	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	445	3.48
B266	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	405	2.7
B267	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	447	3.73

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B268	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	419	3
B269	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3.29
B270	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	449	2.86
B271	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	trifluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	435	3.57
B272	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	390	2.11
B273	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2.59
B274	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2.61
B275	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	391	2.7
B276	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	351	2.01
B277	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,90
B278	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	365	2.26
B279	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2.51
B280	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	395	2.14
B281	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2.78
B282	L1A	ethylimino	ethyl	thioxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.15
B283	L1A	methylimino	propyl	thioxo	H	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3.15
B284	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	410	2.25
B285	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2.73
B286	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2.73
B287	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	411	2.82

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B288	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	371	2.17
B289	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	413	3.04
B290	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	difluoromethyl	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2.65
B291	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	385	1.99
B292	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	374	2.45
B293	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	374	2.45
B294	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	346	1.88
B295	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	388	2.73
B296	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	374	2.37
B297	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	426	2.37
B298	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2.88
B299	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2.86
B300	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	387	2.25
B301	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	429	3.15
B302	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2.78
B303	L1A	methylimino	1-cyclopropyl-2-methoxyethyl	oxo	H	difluoromethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	512	2.94
B304	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	acetylamino	H	H	H	H	H	H	H	H	417	2.08
B305	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	acetylamino	H	H	H	H	H	H	H	H	406	1.87

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B306	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	acetylamino	H	H	H	H	H	H	H	H	418	1.94
B307	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	acetylamino	H	H	H	H	H	H	H	H	378	1.4
B308	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	acetylamino	H	H	H	H	H	H	H	H	420	2.1
B309	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	acetylamino	H	H	H	H	H	H	H	H	406	1.81
B310	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	360	2.07
B311	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	349	2.55
B312	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	349	2.55
B313	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	361	2.65
B314	L1A	methylimino	methyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	321	1.95
B315	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	363	2.84
B316	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	335	2.2
B317	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	349	2,45
B318	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	351	2.73
B319	L1A	methylimino	1-cyclopropyl-2-methoxyethyl	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	405	2.75
B320	L1A	imino	H	thioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	359	3,05
B321	L1A	imino	H	thioxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	327	2,57
B322	L1A	imino	H	thioxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	327	2,47
B323	L1A	imino	propyl	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	353	3,17
B324	L1A	imino	H	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	311	2,09
B325	L1A	imino	prop-2-en-1-yl	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	351	3,08
B326	L1A	ethylimino	ethyl	thioxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3,78
B327	L1A	ethylimino	ethyl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	433	3,37

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B328	L1A	ethylimino	ethyl	thioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	415	3,27
B329	L1A	methylimino	propan-2-yl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	433	3,29
B330	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	thioxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,76
B331	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	thioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	427	3,37
B332	L1A	methylimino	CH_3	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	405	2,73
B333	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	419	3,04
B334	L1A	methylimino	propyl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	433	3,4
B335	L1A	methylimino	2-methylpropyl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	447	3,71
B336	L1A	methylimino	propyl	thioxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3,65
B337	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	thioxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	377	3,23
B338	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	F	H	H	H	R^a_1	H	H	H	H	441	2,62
B339	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	F	H	H	H	R^a_3	H	H	H	H	411	2,73
B340	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	444	2,82
B341	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	401	2,94
B342	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	thioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	455	3,35
B343	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	thioxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	410	3,02
B344	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	thioxo	H	H	H	H	H	R^a_3	H	H	H	H	419	3,02

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B345	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	F	H	H	H	R^a_2	H	H	H	H	407	3,25
B346	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,23
B347	L1A	ethylimino	methoxy	oxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	384	2,92
B348	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	465	3,29
B349	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	397	3,44
B350	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	385	2,71
B351	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	385	2,88
B352	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	433	3,23
B353	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	417	2,86
B354	L1A	methylimino	CH_3	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	357	2,1
B355	L1A	methylimino	CH_3	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	389	2,58
B356	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,25
B357	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	429	3,33
B358	L1A	methylimino	ethyl	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	371	2,39
B359	L1A	methylimino	CH_3	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	369	2,71
B360	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,15
B361	L1A	methylimino	2-methoxyethyl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	433	2,75
B362	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	431	3,58
B363	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	428	2,68

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B364	L1A	methylimino	CH_3	oxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroethoxy	H	H	H	H	H	H	H	H	437	2,64
B365	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	397	3,33
B366	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	408	2,8
B367	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	409	3,53
B368	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	411	3,78
B369	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	cyano	H	H	H	H	H	H	H	H	396	2,45
B370	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	H	H	437	2,86
B371	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	421	2,75
B372	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	methylsulfanyl	H	H	H	H	H	H	H	H	417	2,96
B373	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	405	3,06
B374	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	397	3,42
B375	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	397	2,82
B376	L1A	methylimino	butyl	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3,09
B377	L1A	methylimino	CH_3	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	357	2,25
B378	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	371	2,55
B379	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	385	2,86
B380	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3,19

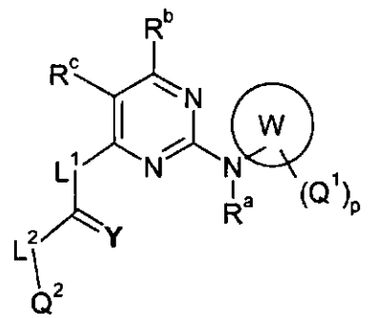
Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B381	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	397	2,98
B382	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	407	2,86
B383	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	385	2,78
B384	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	396	2,35
B385	L1A	methylimino	CH_3	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	405	2,59
B386	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	419	2,88
B387	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	433	3,23
B388	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	447	3,58
B389	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	444	2,69
B390	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	445	3,31
B391	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	433	3,15
B392	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	455	3,19
B393	L1A	methylimino	CH_3	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	389	2,25
B394	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	403	2,55
B395	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	431	3,15
B396	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	417	2,78
B397	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	428	2,37
B398	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	439	2,84
B399	L1A	methylimino	propyl	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	417	2,86
B400	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2,44
B401	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	H	H	H	H	R^a_1	H	H	H	H	433	2,37

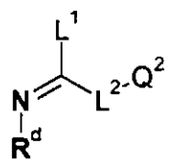
Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B402	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	H	H	H	H	R^{a2}	H	H	H	H	399	2,98
B403	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	H	Cl	H	H	H	R^{a2}	H	H	H	H	432	2,77
B404	L1A	oxo	H	oxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	328	2,11
B405	L1A	imino	H	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	343	2.04[c]
B406	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	358	2,55
B407	L1A	oxo	H	oxo	H	H	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	344	1,98
B409	L1A	methylimino	ethyl	oxo	H	H	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	401	2,57
B410	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	H	H	427	2,98

Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B411	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	H	H	F	CHF_2	H	H	H	H	H	H	429	2,98
B412	L1A	methylimino	methoxy	oxo	H	H	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	387	2,34
B413	L1A	ethylimino	methoxy	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	401	2,64
B414	L1A	ethylimino	ethoxy	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2,88
B415	L1A	methylimino	ethoxy	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	401	2,57
B416	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	methoxy	F	H	H	H	H	H	H	H	356	2,43
B417	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	methoxy	Cl	H	H	H	H	H	H	H	372	2,80
B418	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	F	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	356	2,37
B419	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	H	CH_3	Cl	H	H	H	H	H	H	356	3,17
B420	L1A	ethylimino	prop-2-yn-1-yl	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	409	2,86
B421	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	methoxy	bromo	H	H	H	H	H	H	H	416	2,90

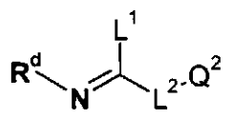
Example Number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q^1)^1$	$(Q^1)^2$	$(Q^1)^3$	$(Q^1)^4$	$(Q^1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	Measured MW	log p
B422	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	methoxy	methoxy	H	H	H	H	H	H	H	368	2.02[c]
B423	L1A	methylimino	CH_3	thioxo	H	H	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	387	2,66
B424	L1A	methylimino	ethyl	thioxo	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,06

Abbreviations: R^{a1} = methoxyacetyl; R^{a2} = prop-2-yn-1-yl; R^{a3} = acetyl

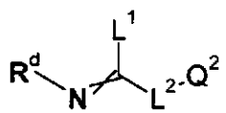




E



Z



double bond either:
E,Z mixture
or double bond geometry not specified

The double bond geometry of C=Y of the following compounds of table II is double bond either (a mixture of E,Z-isomers or double bond geometry not specified):

B29, B30, B31, B32, B34, B35, B36, B37, B38, B39, B40, B41, B42, B43, B44, B46, B47, B48, B49, B50, B53, B54, B55, B58, B60, B64, B65, B68, B69, B70, B72, B73, B74, B79, B80, B84, B85.

The double bond geometry of C=Y of the following compounds of table II is E :

B104, B106, B107, B108, B109, B110, B111, B27, B75, B76, B77, B78, B81, B82, B83, B90.

Of course all stereoisomeric forms (E, Z, mixture of E,Z = double bond either) are claimed in this invention.

Measurement of logP values was performed according EEC directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) on reversed phase columns with the following methods:

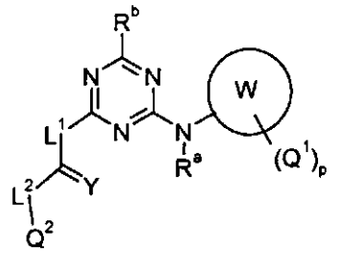
Usually measurement of LC-MS was done at pH 2,7 with 0,1 % formic acid in water and with acetonitrile (contains 0,1% formic acid) as eluent with a linear gradient from 10 % acetonitrle to 95 % acetonitrile.

[b] Measurement was done at pH 2.3 with 0,1% phosphoric acid and acetonitrile as eluent.

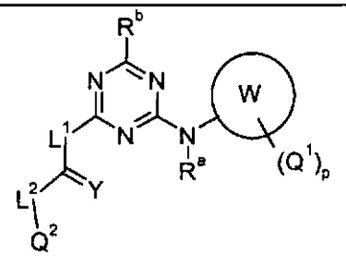
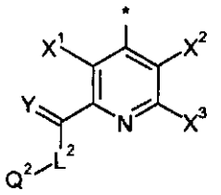
[c] Measurement with LC-MS was done at pH 7.8 with 0,001 molar ammonium hydrogen carbonate solution in water as eluent with a linear gradient from 10 % acetonitrile to 95 % acetonitrile.

Calibration was done with not branched alkan2-ones (with 3 to 16 carbon atoms) with known logP-values (measurement of logP values using retention times with linear interpolation between successive alkanones).. lambda-maX-values were determined using UV-spectra from 200 nm to 400 nm and the peak values of the chromatographic signals.

Table III:



Formula (III_1)

Formula (IV)	In **table III** we use the same abbreviations for *-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2 as in table I.	
	*-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2	Abbreviation
 Formula (III_1) Whereas W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different		L1A

5

Example number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	HET-(Q1)p	X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	Measured MW	log p
C1	L1A	bond	pyrrolidin-1-yl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	378	1,99[c]
C2	L1A	bond	piperidin-1-yl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	392	2,14[c]
C3	L1A	propylimino	propyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	408	2,77[c]
C4	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	380	2,11[c]
C5	L1A	methylimino	propyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	380	2,11[c]
C6	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	392	2.2
C7	L1A	prop-2-en-1-ylimino	prop-2-en-1-yl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	404	2,58[c]
C8	L1A	methylimino	methyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	352	1.57
C9	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	394	2.37
C10	L1A	methylimino	ethyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	366	1.82
C11	L1A	ethylimino	butyl	oxo	6-methoxypyridin-3-yl	H	H	H	H	H	408	2.78
C12	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	366	1.89
C13	L1A	ethylimino	ethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	355	2.44
C14	L1A	methylimino	propyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	355	2.45
C15	L1A	methylimino	cyclopropylmethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	367	2.53
C16	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	369	2.63
C17	L1A	methylimino	ethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	341	2.13
C18	L1A	methylimino	2-methylpropyl	oxo	pyridin-4-yl	H	H	H	H	H	364	1.19
C19	L1A	methylimino	CH_3	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	327	1.86
C20	L1A	methylimino	propan-2-yl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	355	2.37
C21	L1A	methylimino	2,2-difluoroethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	377	2.46
C22	L1A	ethylimino	ethyl	S	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	371	3.02

Example number	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	HET-(Q1)p	X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	Measured MW	log p
C23	L1A	methylimino	ethyl	S	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	357	2.68
C24	L1A	O	CH_3	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	314	2.23
C25	L1A	O	CH_3	oxo	2-chloropyridin-4-yl	H	H	H	H	H	343	2.02
C28	L1A	O	H	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	300	1.62
C29	L1A	methylimino	2-cyanoethyl	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	CH_3CO	H	408	1.78
C30	L1A	methylimino	methoxy	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	343	2.05
C31	L1A	ethylimino	ethoxy	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	371	2.59
C32	L1A	ethylimino	methoxy	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	357	2,33[c]
C33	L1A	methylimino	ethoxy	oxo	thiophen-3-yl	H	H	H	H	H	357	2.26

Measurement of logP values was performed according EEC directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) on reversed phase columns with the following methods:

Usually measurement of LC-MS was done at pH 2,7 with 0,1 % formic acid in water and with acetonitrile (contains 0,1% formic acid) as eluent with a linear gradient from 10 % acetonitrle to 95 % acetonitrile.

[b] Measurement was done at pH 2.3 with 0,1% phosphoric acid and acetonitrile as eluent.

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

Preparation of ethyl 4-{2-[(6-methoxypyridin-3-yl)amino]pyrimidin-4-yl}pyridine-2-carboxylate (Compound A-1)

150 mg of ethyl 3-[3-(dimethylamino)prop-2-enoyl]pyridine-2-carboxylate (0.6 mmol), 138 mg of 1-(6-methoxypyridin-3-yl)guanidine nitrate (0.6 mmol) and 64 mg of sodium carbonate (0.6 mmol) were stirred for 8 hours at reflux in 3.38 ml of 2-methoxyethanol. After cooling water was added and the precipitate was filtered and dried to yield 65 mg of ethyl 4-{2-[(6-methoxypyridin-3-yl)amino]-pyrimidin-4-yl}pyridine-2-carboxylate (yield = 53 %) [M + 1] = 352.

Preparation of 4-{2-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]pyrimidin-4-yl}-N-ethyl-N-methylpyridine-2-carboxamide (Compound A-17) and N-ethyl-4-[2-({2-[ethyl(methyl)carbamoyl]pyridin-4-yl}amino)pyrimidin-4-yl]-N-methylpyridine-2-carboxamide (Compound A-19) according to process P1A

Step1: Preparation of di-tert-butyl {(*Z*)-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]methylylidene}biscarbamate:

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

Step2: Preparation of 1-(2-chloropyridin-4-yl)guanidine bis(trifluoroacetate):

To a solution of 43.67 g (0.117mol) of di-tert-butyl {(*Z*)-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]methylylidene}biscarbamate in dichloromethane (800ml) at room temperature were added 81.64ml of trifluoroacetic acid (1.06 mol). The reaction mixture was stirred at room temperature for 2 days, concentrated *in vacuo*, triturated with 100ml of pentane, and upon standing crystallized to yield 51.68g of 1-(2-chloropyridin-4-yl)guanidine bis(trifluoroacetate) (yield = 99%). [M + 1-2*CF_3CO_2H] = 171

Step 3: Preparation of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine according to process A-1:

To a solution of 6.32g of 1-(2-chloropyridin-4-yl)-3-(dimethylamino)prop-2-en-1-one (30 mmol) in 60ml of 2-Propanol was added 2.52g of sodium hydroxide (63mmol) and 11.96g of 1-(2-chloropyridin-4-yl)guanidine bis(trifluoroacetate) (30mmol). The reaction mixture was heated to reflux under stirring for 20h. After filtration, the precipitate was washed with 100ml of *n*-butanol and 120ml of i-Pr_2O and then air-dried to yield 4.69g of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (yield = 37%). [M + 1] = 318

Step 4: Preparation of 4-{2-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]pyrimidin-4-yl}-N-ethyl-N-methylpyridine-2-carboxamide (Compound A-17) and N-ethyl-4-[2-({2-[ethyl(methyl)carbamoyl]pyridin-4-yl}amino)pyrimidin-4-yl]-N-methylpyridine-2-carboxamide (Compound A-19)

200 mg of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (0.63 mmol), 111 mg of N-Methyl-N-ethylamine (1.89 mmol), 166 mg of molybdenum hexacarbonyl (0.631mmol), 0.282ml of 1,8-Diazabicyclo(5.4.0)undec-7-ene (1.89 mmol) and 72.9 mg (0.063 mmol) of Tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0) were diluted in 5 ml of N,N-dimethylformamide. The reaction mixture was stirred at 100°C for 5 hours. After cooling, 10 ml of a saturated NH4Cl was added and the mixture was extracted with 5 ml of dichloromethane. After evaporation of the solvent the crude product was chromatographed on silica (dichloromethane / ethanol) to yield 58 mg of 4-{2-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]pyrimidin-4-yl}-N-ethyl-N-methylpyridine-2-carboxamide (yield = 22 %) [M + 1] = 479 and 130 mg of N-ethyl-4-[2-({2-[ethyl(methyl)carbamoyl]pyridin-4-yl}amino)pyrimidin-4-yl]-N-methylpyridine-2-carboxamide (yield = 44 %) [M + 1] = 420.

Preparation of 4-{2-[(5-tert-butyl-2-thienyl)amino]pyrimidin-4-yl}-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (compound A-39) according to process P12

Step 1: Preparation of N,N-diethyl-4-iodopyridine-2-carboxamide

To a solution of 24.5 g (93.4 mmol) 4-iodopyridine-2-carboxylic acid in 600 ml dichloromethane was added under an argon atmosphere 34 ml (197 mmol) N,N-diisopropylethylamine. After cooling to 0 °C 12.7 ml (103 mmol) 2,2-dimethylpropionylchloride was added dropwise and stirred for 1 h at ° C followed by the dropwise addition of 20.3 ml (197 mmol) diethylamine. Stirring was continued for 1 hour at 0 °C and 1 hour at room temperature. Then 300 ml water was added and the aqueous phase extracted additional two times with 100 ml dichloromethane. The combined organic layers were dried and the solvent was removed in vacuo. The crude product was purified by chromatography on silica (heptane / ethyl acetate) to yield 23.4 g N,N-diethyl-4-iodopyridine-2-carboxamide (yield = 72 %) [M + 1] = 305.

Step 2: Preparation of N,N-diethyl-4-(tributylstannyl)pyridine-2-carboxamide

5 g (16.44 mmol) of N,N-diethyl-4-iodopyridine-2-carboxamide (obtained from step 1) was dissolved under an argon atmosphere in 40 ml of 1,4-dioxane followed by the addition of 19.075 g (32.88 mmol) hexabutylditin and 0.577 g (0.822 mmol) dichlorobis(triphenylphosphine)palladium(II). The mixture was refluxed for 3 hours. After cooling the suspension was passed through a 10 g silica cartridge, the cartridge was rinsed with 10 ml 1,4-dioxane and the solvent was removed in vacuo. The crude product was purified by chromatography on silica (heptane / ethyl acetate) to yield 4.27 g of N,N-diethyl-4-(tributylstannyl)pyridine-2-carboxamide (yield = 55 %) [M + 1] = 468.

Step 3: Preparation of 4-(2-chloropyrimidin-4-yl)-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide

A solution of 2.5 g (5.35 mmol) N,N-diethyl-4-(tributylstannyl)pyridine-2-carboxamide (obtained from step 2) in 18 ml 1,4-dioxane was placed in a 20 ml microwave tube followed by the addition of 1.03 g (7 mmol) 2,4-dichloropyrimidine and 0.62 g (0.535 mmol) Tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0). The mixture was microwaved in a Biotage Optimizer at 150 °C for 20 minutes. After cooling 20 ml of dichloromethane was added, the resulting suspension was filtrated and the filtrate was concentrated in vacuo. To the obtained residue was added 50 ml of saturated potassium fluoride solution and stirred for 15 min followed by the extraction with ethyl acetate. The combined organic layers were dried, evaporated and the crude product was purified by chromatography on silica (heptane / ethyl acetate) followed by chromatography on silica (dichloromethane / acetone) to yield 400 mg 4-(2-chloropyrimidin-4-yl)-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (yield = 25 %). [M + 1] = 291.

Step 4: Preparation of tert-butyl (5-tert-butyl-2-thienyl)carbamate

Under an argon atmosphere 1 g (5.4 mmol) 5-tert-butylthiophene-2-carboxylic acid was dissolved in 10 ml of tert-butanol. After the addition of 1.54 g (5.4 mmol) diphenylphosphoroazidate and of 0.76 ml (5.4 mmol) triethylamine the resulting mixture was refluxed for 6 hours followed by stirring at 50 °C for 16 hours. After cooling 50 ml of water was added and the mixture was extracted 3 times with 10 ml of ethyl acetate. The combined organic layers were dried and after evaporation of the solvent the crude product was purified by chromatography on silica (heptane / ethyl acetate) to yield 415 mg of tert-butyl (5-tert-butyl-2-thienyl)carbamate (yield = 30 %).

Step 5: Preparation of 4-{2-[(5-tert-butyl-2-thienyl)amino]pyrimidin-4-yl}-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (compound A-39)

To a solution of 105 mg (0.41 mmol) tert-butyl (5-tert-butyl-2-thienyl)carbamate (obtained from step 4) in 3 ml of 1,4-dioxane were added 100 mg (0.34 mmol) 4-(2-chloropyrimidin-4-yl)-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (obtained from step 3) and 98 mg (0.51 mmol) 4-toluenesulfonic acid monohydrate and refluxed for 20 hourss. After cooling 3 ml of water was added and the mixture was extracted 3 times with 3 ml of dichloromethane. The combined organic layers were dried and after evaporation of the solvent the crude product was purified by chromatography on silica to yield 60 mg of 4-{2-[(5-tert-butyl-2-thienyl)amino]pyrimidin-4-yl}-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (yield = 41 %) [M + 1] = 410.

Preparation of N,N-diethyl-4-[5-methyl-2-(3-thienylamino)pyrimidin-4-yl]pyridine-2-carboxamide (compound A-41) according to process P12

Step 1: Preparation of 4-(2-chloro-5-methylpyrimidin-4-yl)-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide

A solution of 1 g (2.05 mmol) N,N-diethyl-4-(tributylstannyl)pyridine-2-carboxamide (obtained from step 2 compound A-39) in 8 ml 1,4-dioxane was placed in a 10 ml microwave tube followed by the addition of 435 mg (2.67 mmol) 2,4-dichloro-5-methylpyrimidine and 0.23 g (0.2 mmol) Tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0). The mixture was microwaved in a Biotage Optimizer at 150 °C for 20 minutes. After cooling 10 ml of dichloromethane was added, the resulting suspension was filtrated and the filtrate was concentrated in vacuo. To the obtained residue was added 20 ml of saturated potassium fluoride solution and stirred for 15 min followed by the extraction with ethyl acetate. The combined organic layers were dried, evaporated and the crude product was purified by chromatography on silica (heptane / ethyl acetate) to yield 400 mg of 4-(2-chloro-5-methylpyrimidin-4-yl)-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (yield = 30 %) [M + 1] = 306.

Step 2: Preparation of N,N-diethyl-4-[5-methyl-2-(3-thienylamino)pyrimidin-4-yl]pyridine-2-carboxamide (compound A-41)

To a solution of 60 mg (0.2 mmol) 4-(2-chloro-5-methylpyrimidin-4-yl)-N,N-diethylpyridine-2-carboxamide (obtained from step 1) in 3 ml of 1,4-dioxane were added 144 mg (0.76 mmol) thiophen-3-ylamine oxalic acid salt and 21 mg (0.11 mmol) 4-toluenesulfonic acid monohydrate and refluxed for 10 days. After cooling 3 ml of water was added and the mixture was extracted 3 times with 3 ml of dichloromethane. The combined organic layers were washed succesively with 2 ml of 1M NaOH, 2 ml of 1M HCl and brine. After evaporation of the solvent the crude product was purified by prep hplc to yield 3 mg of N,N-diethyl-4-[5-methyl-2-(3-thienylamino)pyrimidin-4-yl]pyridine-2-carboxamide (yield = 4 %) [M + 1] = 368.

Preparation of 1-{4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)ethanone (Compound B-26) according to process P1

Step 1:

Preparation of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carbonitrile

To a solution of 70 g of N-(3-chlorophenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine (prepared as described in WO 2005/033095) in 350 ml of N,N-dimethylformamide were added under argon 38.75 g (330 mmol) zink cyanide and 50.85 g (44 mmol) Tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0). The mixture was heated for 3 hours at 100 °C. After cooling the resulting slurry was filtered, the precipitate was washed with N,N-dimethylformamide and the combined filtrates were evaporated. The remaining solid was recrystallized from dichloromethane yielding 54.39 g of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carbonitrile (yield = 80 %) [M + 1] = 310.

Step 2:

To 130 ml of tetrahydrofuran was added 26 ml of a 3 M solution of methylmagnesium bromide in toluene and cooled to 0 °C. Then 8 g (26 mmol) of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carbonitrile was added in small portions and stirring was continued for 3 hours at 0 °C. After warming to room temperature stirring was continued for 4 hours. Then 120 ml of 1N HCl was added and the mixture was extracted with ethyl acetate. The combined organic phases were dried and evaporated to yield 8.13 g of 1-(4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)ethanone (yield = 96 %) [M + 1] = 327.

Preparation of N-(3-chlorophenyl)-4-{2-[(1*E*)-N-methoxyethanimidoyl]pyridin-4-yl}-1,3,5-triazin-2-amine (Compound B-27) according to process P2

50 mg (0.15 mmol) of 1-(4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)ethanone, 26 mg (0.3 mmol) of O-methylhydroxylamine hydrochloride and 26 mg (0.31 mmol) sodium acetate dissolved in 3 ml ethanol were stirred at reflux for 6 hours. After cooling the solvent was evaporated in vacuo and 5 ml of water was added. The solid was filtrated, washed with water and dried to yield 21 mg of N-(3-chlorophenyl)-4-{2-[(1*E*)-N-methoxyethanimidoyl]pyridin-4-yl}-1,3,5-triazin-2-amine (yield = 35 %) [M + 1] = 356.

Preparation of 3-{2-[1-(4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)ethylidene]hydrazinyl}propanenitrile (Compound B-81) according to process P2

To a solution of 200 mg (0.62 mmol) 1-(4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)ethanone, 0.028 ml (0.49 mmol) acetic acid and 51 mg (0.62 mmol) sodium acetate in 2 ml

methanol was added 52 mg (0.62 mmol) of 3-hydrazinylpropanenitrile dissolved in 2 ml of methanol and stirred at reflux for 2 hours and at room temperature overnight. The solvent was evaporated in vacuo and 30 ml of water was added. The mixture was extracted with dichloromethane, the combined organic phases were dried and evaporated to yield 1280 mg of 3-{2-[1-(4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)ethylidene]hydrazinyl}propanenitrile (yield = 53 %) [M + 1] = 394.

Preparation of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N'-hydroxypyridine-2-carboximidamide (Compound B-78) according to process P1

A solution of 1.5 g (4.86 mmol) of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carbonitrile, 675 mg (9.7 mmol) hydroxylamine hydrochloride and 1.34 g (9.7 mmol) potassium carbonate dissolved in 20 ml ethanol was stirred at room temperature for 5 hours. After evaporation of the solvent water was added and the remaining solid was filtered and dried to yield 1.566 g of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N'-hydroxypyridine-2-carboximidamide (yield = 94 %) [M + 1] = 343.

Preparation of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N'-[(methoxyacetyl)oxy]pyridine-2-carboximidamide (Compound B-104)

A solution of 200 mg (0.58 mmol) of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N'-hydroxypyridine-2-carboximidamide, 63 mg (0.58 mmol) methoxyacetyl chloride and 49 mg (0.58 mmol) sodium bicarbonate dissolved in 5 ml acetone was stirred at room temperature for 16 hours. After evaporation of the solvent 30 ml of water was added and the remaining solid was filtered and dried to yield 145 mg of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N'-[(methoxyacetyl)oxy]pyridine-2-carboximidamide (yield = 60 %) [M + 1] = 415.

Preparation of ethyl 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboximidoate (Compound B-102) according to process P1

A solution of 200 mg (0.65 mmol) 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carbonitrile, 126 mg (1.3 mmol) O-ethylhydroxylamine hydrochloride and 179 mg 1.3 mmol) potassium carbonate dissolved in 20 ml ethanol was stirred at 70 °C for 5 hours. After cooling and evaporation of the solvent water was added and the remaining solid was filtered and dried to yield 178 mg of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboximidoate (yield = 74 %) [M + 1] = 356.

Preparation of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N-hydroxypyridine-2-carboxamide (Compound B-185) according to process P9

Step 1: Preparation of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboxylic acid

To a solution of 3 g (9.7 mmol) of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carbonitrile in 60 ml of ethanol was added 1.166 g (29.1 mmol) sodium hydroxide dissolved in 35 ml water. The mixture was heated at reflux for 2 hours. After cooling water was added and the mixture acidified with 1 N HCl. The precipitate which formed was filtered, washed with water and dried to yield 2.6 g of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboxylic acid (yield = 81 %) [M + 1] = 329

Step 2: Preparation of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N-hydroxypyridine-2-carboxamide

To a solution of 500 mg (1.53 mmol) of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboxylic acid dissolved in 6 ml of dimethylformamide were added 463 mg (4.58 mmol) triethylamine, 212 mg (3.05 mmol) hydroxylamine hydrochloride and 696 mg (1.83 mmol) O-(7-Azabenzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetra-methyluronium hexafluorophosphate. The mixture was stirred at room temperature for 16 hours. After addition of water the mixture was extracted with dichloromethane and the organic layer was washed successively with 1 N HCl, saturated sodium bicarbonate and saturated lithium chloride solution. After evaporation of the solvent the residue was stirred with methanol, filtered and dried to yield 165 mg of 4-{4-[(3-chlorophenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-N-hydroxypyridine-2-carboxamide (yield = 29 %) [M + 1] = 344.

Preparation of N-ethyl-N-methyl-4-(4-{[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanyl)phenyl]amino}-1,3,5-triazin-2-yl)pyridine-2-carbothioamide (Compound B-253) according to process P10

To 130 mg (0.28 mmol) of N-ethyl-N-methyl-4-(4-{[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanyl)phenyl]amino}-1,3,5-triazin-2-yl)pyridine-2-carboxamide dissolved in 5 ml of toluene was added 31.4 mg (0.14 mmol) of phosphorous pentasulfide. The reaction mixture was stirred under reflux for two hours, then 2ml of water were added and the reaction mixture was stirred at 100°C for one hour. After cooling, water was removed by filtration on solid-phase extraction cartridge . After rinsing of the cartridge with 3ml of toluene, the filtrate was purified by chromatography on silica (dichloromethane / ethanol) to yield 55 mg of N-ethyl-N-methyl-4-(4-{[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanyl)phenyl]amino}-1,3,5-triazin-2-yl)pyridine-2-carbothioamide (yield = 41 %) [M + 1] = 477.

Preparation of N-(4-{2-[(cyclopropylmethyl)(methyl)carbamothioyl]pyridin-4-yl}-1,3,5-triazin-2-yl)-N-phenylacetamide (compound B-344)

118 mg (0.71 mmol) of lithium hexamethyldisilazane were added to 263 mg (0.64 mmol) of 4-(4-anilino-1,3,5-triazin-2-yl)-N-(cyclopropylmethyl)-N-methylpyridine-2-carbothioamide (prepared analogously to compound B-253) dissolved in 5 ml anhydrous tetrahydrofuran. After stirring for 30 minutes 55 mg (0.71 mmol) of acetyl chloride was added and stirring continued for 20 hours. 5 ml of water were then added and the organic phase is filtered through a Chemelute cartridge. Dichloromethane ifollowed by ethyl acetate were used to rinse the cartridge and the concentrated organic phases are purified on a silica gel column (ethyl acetate / dichloromethane) followed by prep rp-hplc to give 110 mg of N-(4-{2-[(cyclopropylmethyl)(methyl)carbamothioyl]pyridin-4-yl}-1,3,5-triazin-2-yl)-N-phenylacetamide (yield = 39 %) [M + 1] = 419.

Preparation of N-(cyclopropylmethyl)-N-methyl-4-{4-[phenyl(prop-2-yn-1-yl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboxamide (compound B-402)

371 mg (2.22 mmol) of lithium hexamethyldisilazane were added to 400 mg (1.11 mmol) of 4-(4-anilino-1,3,5-triazin-2-yl)-N-(cyclopropylmethyl)-N-methylpyridine-2-carboxamide (prepared analogously to compound C-2) dissolved in 5 ml anhydrous tetrahydrofuran. After stirring for 30 minutes 330 mg (2.22 mmol) of 3-bromoprop-1-yne was added and stirring continued for 20 hours. 4 ml of water were then added and the organic phase is filtered through a Chemelute cartridge. Dichloromethane is used to rinse the cartridge and the concentrated organic phases are purified on a silica gel column (ethyl acetate / dichloromethane) to give 180 mg of N-(cyclopropylmethyl)-N-methyl-4-{4-[phenyl(prop-2-yn-1-yl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridine-2-carboxamide (yield = 26 %) [M + 1] = 399.

Preparation of (4-{4-[(6-methoxypyridin-3-yl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)(piperidin-1-yl)methanone (Compound C-2) according to process P1

Step 1: Preparation of 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-methoxypyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine:

To a solution of 3.406 g (15 mmol) of 2-chloro-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazine (prepared as described in WO 2001/25220) and of 1.862 g (15 mmol) 6-methoxypyridin-3-amine in 250 ml of acetonitrile was added 2.073 g (15 mmol) of potassium carbonate. The reaction mixture was stirred for 3 days. After evaporation of the solvent the residue was treated with water, filtrated and dried to yield 4.0 g of 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-methoxypyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine (yield = 84 %) [M + 1] = 316.

Step 2: Preparation of (4-{4-[(6-methoxypyridin-3-yl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)(piperidin-1-yl)-methanone (compound C-2)

300 mg of 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-methoxypyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine (0.95 mmol), 243 mg of piperidine (2.86 mmol), 252 mg of molybdenum hexacarbonyl (0.95 mmol), 0.427 ml of 1,8-Diazabicyclo(5.4.0)undec-7-ene (2.86 mmol) and 110 mg (0.095 mmol) of Tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0) were diluted in 8 ml of N,N-dimethylformamide. The reaction mixture was stirred at 80°C for 5 hours. After cooling, 10 ml of a saturated ammonium chloride solution was added and the mixture was extracted with 5 ml of dichloromethane. After evaporation of the solvent the crude product was chromatographed on silica (dichloromethane / ethanol) to yield 99 mg of (4-{4-[(6-methoxypyridin-3-yl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}pyridin-2-yl)(piperidin-1-yl)-methanone (yield = 26 %) [M + 1] = 393.

Preparation of N-methoxy-N-methyl-4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxamide (compound C-30) according to process P9

Step 1: Preparation of methyl 4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxylate (compound C-24) according to process P12

To a solution of 5 g (20 mmol) of methyl 4-(4-chloro-1,3,5-triazin-2-yl)pyridine-2-carboxylate (prepared as described in WO 2007/003525) and of 7.55 g (40 mmol) thiophen-3-ylamine oxalic acid salt in 150 ml of acetonitrile was added 5.5 g (40 mmol) of potassium carbonate. The reaction mixture was stirred for 7 hours at room temperature. The resulting suspension was filtered, the precipitate was washed with water followed by acetonitrile and finally diisopropylether to yield 3.7 g of methyl 4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxylate (yield = 58 %) [M + 1] = 314.

Step 2: Preparation of 4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxylic acid (compound C-28)

2 g (6.38 mmol) of (methyl 4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxylate (obtained from step 1) was suspended in 20 ml tetrahydrofuran followed by the addition of 19 ml 1M lithium hydroxide. The mixture was stirred at room temperature for 30 minutes and then the tetrahydrofuran was evaporated. The resulting aqueous solution was kept overnight whereas a precipitate was formed which was removed by filtration. The filtrate was acidified to pH 2 with 2 N HCl. The precipitate formed was filtrated and dried to yield 1.9 g of 4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxylic acid (yield = 97 %) [M + 1] = 300.

Step 3: Preparation of N-methoxy-N-methyl-4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxamide (compound C-30)

To a solution of 200 mg (0.67 mmol) of 4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxylic acid (obtained from step 2) dissolved in 7 ml of dimethylformamide were added 203 mg (2 mmol) triethylamine, 130 mg (1.34 mmol) N,O-dimethylhydroxylamine hydrochloride and 305 mg (0.8 mmol) O-(7-Azabenzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetra-methyluronium hexafluorophosphate. The mixture was stirred at room temperature for 22 hours. After addition of water the mixture was extracted with dichloromethane and the organic layer was washed successively with 1 N HCl, saturated sodium bicarbonate and brine. After drying the solvent was evaporated to yield 195 mg of N-methoxy-N-methyl-4-[4-(3-thienylamino)-1,3,5-triazin-2-yl]pyridine-2-carboxamide (yield = 81 %) [M + 1] = 343.

Biological Examples

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

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

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

Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material. After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Peronospora parasitica* spores (50 000 spores per ml). The spores are collected from infected plant.

The contaminated cabbage plants are incubated for 5 days at 20°C, under a humid atmosphere. Grading is carried out 5 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: A5, A11, B2, B6, B20, B27, B64, B76, B111, B116, B119, B123, B127, B129, B130, B132, B133, B134, B135, B139, B150, B151, B152, B156, B157, B158, B162, B163, B164, B165, B169, B170, B172, B173, B179, B180, B181, B186, B222, B236, B238, B239, B244, B254, B256, B258, B260, B268, B316, C2, C16.

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

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

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

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

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: A13, A15, A25, A26, A27, A29, A30, A31, A32, B1, B2, B6, B7, B20, B64, B115, B123, B124, B125, B127, B130, B131, B132, B133, B134, B135, B141, B143, B144, B146, B147, B148, B149, B150, B151, B152, B153, B155, B156, B157, B160, B161, B162, B163, B165, B169, B179, B186, B222, B236, B237, B238, B244, B254, B260, B268, B316, C5, C9, C11, C12, C16.

Example C : *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, then diluted with water to obtain the desired active material.

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

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 cm^3). The spores are collected from a 12 to 13 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: B54, B55, B64, B91, B93, B94, B97, B115, B123, B124, B125, B127, B130, B131, B132, B133, B134, B135, B137, B138, B141, B142, B143, B144, B146, B148, B151, B152, B153, B156, B158, B159, B160, B161, B162, B165, B166, B167, B169, B171, B183, B184, B186.

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

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

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

After 24 hours, the plants are contaminated 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.

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

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: A5, A18, A24, A26, A27, A29, A30, A32, B2, B6, B7, B20, B123, B127, B222, B225, B236, B239, B244, B254, B256, B258, B260, B268, C5, C10.

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

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

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

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

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Pyrenophora teres* spores (12,000 spores per ml). The spores are collected from a 12-day-old culture. The contaminated barley plants are incubated for 24 hours at about 20°C and at 100% relative humidity, and then for 12 days at 80% relative humidity.

Grading is carried out 12 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: A2, A11, A17, A29, A30, A32, B1, B2, B6, B7, B20, B34, B36, B37, B38, B40, B41, B43, B45, B74, B75, B76, B77, B81, B82, B85, B105, B110, B111, B113, B115, B116, B123, B124, B125, B126, B127, B128, B129, B130, B131, B132, B133, B134, B135, B137, B139, B140, B141, B142, B143, B144, B145, B146, B147, B148, B149, B150, B151, B152, B153, B155, B156, B157, B158, B159, B160, B161, B162, B163, B164, B165, B166, B167, B169, B170, B171, B172, B173, B179, B180, B181, B183, B184, B186, B192, B207, B222, B237, B238, B239, B244, B252, B254, B256, B258, B260, B268, B316, C2, C4, C5, C7, C8, C9, C10, C11, C12, C16.

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

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

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

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

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

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

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: A5, A7, A17, A18, A25, A32, B1, B2, B6, B7, B111, B127, B129,

B130, B132, B133, B146, B150, B151, B152, B157, B158, B159, B160, B161, B162, B163, B164, B165, B169, B170, B172, B186, B236, B237, B256, B316, C4, C5, C8, C9, C10, C11, C12, C16.

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

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

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

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

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

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: B1, B2, B33, B45, B46, B48, B64, B75, B76, B81, B85, B95, B113, B114, B116, B118, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B135, B137, B146, B151, B157, B166, B186, B192, B194, B195, B197, B226, B227, C12.

Example H

Leptosphaeria test (wheat) / preventive

Solvent: 49 parts by weight of N, N - Dimethylformamide

Emulsifier: 1 part by weight of Alkylarylpolyglycolether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for preventive activity, young plants are sprayed with a preparation of active compound at the stated rate of application. One day after this treatment, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of ***Leptosphaeria nodorum***. The plants remain for 48 hours in an

incubation cabinet at 22°C and a relative atmospheric humidity of 100%. Then the plants are placed in a greenhouse at a temperature of approximately 22°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90%.

The test is evaluated 7-9 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the invention showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 500ppm of active ingredient:

A38, B3, B4, B5, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B14, B15, B16, B17, B18, B19, B21, B22, B23, B24, B25, B26, B27, B28, B29, B57, B64, B81, B115, B116, B123, B129, B132, B133, B136, B146, B151, B172, B187, B188, B189, B201, B202, B203, B204, B205, B206, B209, B223, B240, B241, B242, B243, B245, B246, B247, B248, B249, B250, B253, B255, B257, B259, B261, B262, B263, B264, B264, B265, B266, B267, B270, B271, B272, B273, B274, B275, B276, B277, B278, B279, B280, B281, B282, B283, B284, B285, B286, B287, B288, B289, B290, B291, B292, B293, B294, B295, B296, B297, B298, B299, B300, B301, B302, B303, B305, B307, B308, B310, B311, B312, B313, B314, B315, B317, B318, B326, B327, B328, B329, B330, B331, B332, B333, B334, B335, B336, B337, B338, B339, B340, B341, B342, B343, B344, B346, B347, B348, B349, B350, B352, B353, B354, B355, B356, B357, B358, B359, B361, B362, B363, B364, B365, B366, B367, B368, B369, B370, B371, B372, B373, B374, B375, B376, B377, B378, B379, B380, B381, B382, B383, B384, B385, B386, B387, B388, B389, B390, B391, B392, B393, B394, B395, B396, B397, B398, B399, B400, B401, C13, C14, C15, C17, C19, C20, C21, C22, C23.

Example I

Venturia test (apples) / protective

Solvent:	24,5 parts by weight of acetone
	24,5 parts by weight of dimethylacetamide
Emulsifier:	1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous conidia suspension of the causal agent of apple scab (***Venturia inaequalis***) and then remain for 1 day in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 100 %.

The plants are then placed in a greenhouse at approximately 21°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90 %.

The test is evaluated 10 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the invention showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 100ppm of active ingredient:

A29, A30, A32, B2, B3, B4, B5, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B15, B16, B17, B19, B20, B23, B123, B129, B132, B133, B146, B151, B172, B186, B188, B203, B204, B205, B206, B209, B222, B223, B236, B238, B239, B248, B254, B255, B257, B261, B266, B268, B271, B272, B273, B274, B275, B276, B277, B278, B280, B281, B282, B285, B286, B287, B288, B289, B293, B297, B300, B310, B311, B312, B313, B315, B316, B318, B330, B331, B332, B333, B336, B337, B338, B339, B347, B349, B350, B355, B357, B358, B359, B362, B363, B364, B365, B366, B367, B368, B369, B370, B371, B372, B373, B374, B375, B379, B380, B381, B384, B386, B387, B389, B393, B393, B394, B395, B398, B399, B400, B401, C13, C14, C15, C16, C17, C19, C20, C21.

Example J

Uromyces test (beans) / protective

Solvent: 24,5 parts by weight of acetone
24,5 parts by weight of dimethylacetamide
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the causal agent of bean rust (***Uromyces appendiculatus***) and then remain for 1 day in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 100 %.

The plants are then placed in a greenhouse at approximately 21°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90 %.

The test is evaluated 10 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the invention showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 100ppm of active ingredient:

A29, A32, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8, B10, B11, B12, B13, B15, B16, B17, B19, B20, B23, B116, B123, B132, B133, B146, B151, B186, B209, B222, B223, B236, B238, B239, B254, B260, B261, B268, B271, B273, B274, B278, B281, B285, B286, B287, B289, B293, B295, B298, B301, B310, B311, B312, B313, B315, B316, B318, B330, B331, B332, B333, B336, B337, B338, B339, B347, B349, B350, B352, B364, B366, B367, B370, B371, B373, B374, B376, B380, B386, B390, B392, B393, B394, B395, B397, B398, B399, B400, C15, C16, C19, C21.

Example K

Pyricularia test (rice) / protective

Solvent: 28,5 parts by weight of acetone

Emulsifier: 1,5 parts by weight of polyoxyethylene alkyl phenyl ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. One day after spraying, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the causal agent of rice blast **(Pyricularia oryzae)**. The plants are then placed in an incubator at approximately 25°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100% for 1 day.

The test is evaluated 5 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the invention showed efficacy of 80% or even higher at a concentration of 250ppm of active ingredient:
B1, B2, B3, B4, B6, B7, B10, B81, B116, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B141, B151, B159, B160, B162, B169, B170, B172, B186, B187, B222, B240, B254, B256, B260, B266, B271, B278, B285, B286, B287, B288, B289, B313, B315, B318, B347, B349, B353, B359, B367, B373, B374, B375, B385, B389, B390, B394, B399, C9, C15, C16,

Example L

Rhizoctonia test (rice) / protective

Solvent: 28,5 parts by weight of acetone

Emulsifier: 1,5 parts by weight of polyoxyethylene alkyl phenyl ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. One day after spraying, the plants are inoculated with a hypha of the causal agent of rice sheath blight **(Rhizoctonia solani)**. The plants are then placed in an incubator at approximately 25°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100%.

The test is evaluated 4 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the compounds according to the invention of the following structures showed efficacy of 80% or even higher at a concentration of 250ppm of active ingredient:

B1, B2, B3, B4, B6, B7, B10, B20, B64, B74, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B135, B141, B142, B143, B144, B146, B147, B148, B149, B151, B156, B159, B160, B161, B162, B169, B170, B172, B186, B207, B238, B240, B260, B266, B271, B278, B285, B286, B287, B288, B289, B313, B315, B318, B347, B349, B353, B359, B367, B373, B374, B385, B389, B390, B392, B394, B395, B398, B399, C9, C15, C16.

Example M

Cochliobolus test (rice) / protective

Solvent: 28,5 parts by weight of acetone

Emulsifier: 1,5 parts by weight of polyoxyethylene alkyl phenyl ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. One day after spraying, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the causal agent of rice brown spot **(Cochliobolus miyabeanus)**. The plants are then placed in an incubator at approximately 25°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100% for 1 day.

The test is evaluated 4 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the showed efficacy of 80% or even higher at a concentration of 250ppm of active ingredient:

B1, B2, B3, B4, B6, B7, B10, B20, B64, B74, B116, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B135, B141, B142, B143, B144, B146, B147, B148, B151, B153, B156,

B159, B160, B161, B162, B169, B170, B172, B186, B187, B238, B240, B254, B256, B260, B266, B268, B271, B278, B285, B286, B287, B288, B289, B313, B315, B318, B347, B349, B353, B359, B367, B373, B374, B375, B385, B389, B390, B392, B394, B395, B398, B399, C9, C15, C16.

Example N

Phakopsora test (soybeans) / protective

Solvent: 28,5 parts by weight of acetone

Emulsifier: 1,5 parts by weight of polyoxyethylene alkyl phenyl ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. One day after spraying, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the causal agent of soybean rust **(Phakopsora pachyrhizi)**. The plants are then placed in a greenhouse at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 80%.

The test is evaluated 11 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the showed efficacy of 80% or even higher at a concentration of 500ppm of active ingredient:
A17, B3, B129, B132, B133, B186, B209, B287, B366, B371, C9.

Example O

Fusarium nivale (var. majus)-test (wheat) / preventive

Solvent: 49 parts by weight of n,n-dimethylacetamid

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound or active compound combination is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for preventive activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound or active compound combination at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are sprayed with a spore suspension of ***Fusarium nivale (var. majus)***. The plants are placed in a greenhouse under translucent incubation cloches at a temperature of approximately 10°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100%.

The test is evaluated 5 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following.compounds according to the invention showed an efficacy of 70% or even higher at a concentration of 1000ppm of active ingredient:

A29, A30, A38, B1, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B14, B15, B16, B17, B18, B19, B21, B23, B81, B116, B123, B129, B132, B133, B146, B151, B172, B186, B201, B203, B204, B205, B206, B209, B223, B240, B241, B242, B245, B253, B255, B261, B266, B267, B271, B272, B273, B274, B277, B278, B284, B285, B286, B287, B288, B289, B290, B293, B295, B297, B299, B300, B314, B316, B317, B317, B318, B347, B349, B352, B353, B355, B359, B359, B373, B373, B374, B375, B376, B382, B385, B387, B388, B389, B390, B394, B397, B398, B399, C13, C13, C16, C17, C17, C19, C20, C21.

Example P

Puccinia triticina-test (wheat) / preventive

Solvent: 49 parts by weight of n,n-dimethylacetamid

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound or active compound combination is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for preventive activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound or active compound combination at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are sprayed with a spore suspension of ***Puccinia triticina***. The plants remain for 48 hours in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100%. The plants are placed in a greenhouse at a temperature of approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 80%.

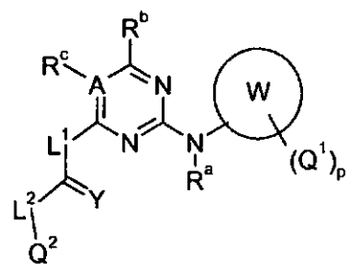
The test is evaluated 8 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following.compounds according to the invention showed an efficacy of 70% or even higher at a concentration of 1000ppm of active ingredient:

A29, A32, A38, B1, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B15, B16, B17, B18, B19, B123, B129, B132, B133, B146, B151, B172, B186, B201, B209, B247, B248, B261, B266, B272, B273, B274, B276, B278, B281, B284, B285, B286, B287, B288, B289, B290, B292, B293, B297, B299, B300, B314, B316, B317, B318, B347, B350, B352, B353, B355, B359, B364, B370, B371, B373, B374, B375, B376, B382, B385, B387, B389, B394, B397, B398, C13, C16, C17, C17, C19, C21.

CLAIMS

1. A substituted-pyridyl-azinylamino derivative of formula (I)



(I)

wherein

- W represents phenyl or a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- A represents a carbon atom or a nitrogen atom provided that if A represents a carbon atom then W represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different
- Q^1 independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl

having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkoxyalkyl, or a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxyalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxyalkycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylthioalkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylthioalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-alkyl, a C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, or a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;
- L^1 represents a substituted or non substituted pyridyl moiety;
- Y represents O, S, NR^d, CR^eR^f ;
- L^2 represents a direct bond, O, S, NR^g, CR^hR^i ;
- Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate

group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- Alternatively, L2 and Q2 can form together a substituted or non-substituted 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h and R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl

group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, , C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_3-C_8-alkynyloxy, C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbamoyl, di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphinyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulphonyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S ; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible;

- Unless indicated otherwise, a group or a substituent that is substituted is substituted by one or more of the following groups or atoms: a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ^6-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-

cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-alkynyloxy, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyloxy, a C_2-C_8-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3-C_8-alkynyloxy, a C_3-C_8-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a di-C_1-C_8-alkylcarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyloxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a N-C_1-C_8-alkyl-C_1-C_8-alkoxycarbamoyl, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a di-C_1-C_8-alkylaminosulfamoyl, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, or phenylamino;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof; provided that the following compounds are excluded:

- (3-{[4-(2-ethenylpyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}phenyl)methanol;
- methyl 4-{4-[(3-{2-[(tert-butoxycarbonyl)amino]ethoxy}phenyl)amino]-1,3,5-triazin-2-yl}-pyridine-2-carboxylate;
- N-{3-[(4-{2-[(1Z)-3-amino-2-chloroprop-1-en-1-yl]pyridin-4-yl}-1,3,5-triazin-2-yl)amino]-benzyl}-N-methylglycine.

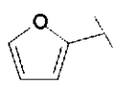
2. A compound of formula (I) according to claim 1 wherein W represents a phenyl and A represents a nitrogen atom.

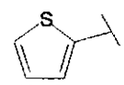
3. A compound of formula (I) according to claim 1 wherein W represents a a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different.

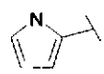
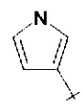
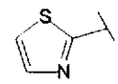
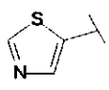
4. A compound of formula (I) according to claim 1 wherein A represents a nitrogen atome and W represents a a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different.

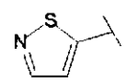
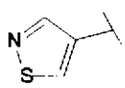
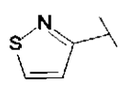
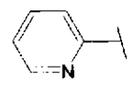
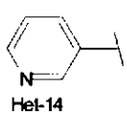
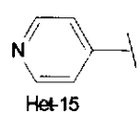
5. A compound of formula (I) according to claim 1 wherein A represents a carbon atome and W represents a a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different.

6. A compound of formula (I) according to claims 1 to 5 wherein W represents phenyl or a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic heterocycle selected in the list consisting of:


Het-1 ;

Het-2 ;

Het-3 ;

Het-4 ;

Het-5 ;

Het-6 ;

Het-7 ;

Het-8 ;

Het-9 ;

Het-10 ;

Het-11

Het-12

Het-13 ;

Het-14 ;

Het-15 .

7. A compound of formula (I) according to claims 1 to 6 wherein Q^1 represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro- ^{6}-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, a C_1-C_8-alkyl, a tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, a C_2-C_8-alkynyl, a C_1-C_8-alkylamino, a di-C_1-C_8-alkylamino, a C_1-C_8-alkoxy, a C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulfanyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkoxycarbonyl, a C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylcarbonylamino, a C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, a C_1-C_8-alkylsulphenyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-alkylsulphinyl, a C_1-C_8-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible.

8. A compound of formula (I) according to claims 1 or 7 wherein p represents 0, 1, 2, or 3.

9. A compound of formula (I) according to claims 1 to 8 wherein p represents 1.

10. A compound of formula (I) according to claims 1 to 9 wherein R^a represents a hydrogen atom or a substituted or non substituted C_1-C_8-cycloalkyl.

11. A compound of formula (I) according to claims 1 to 10 wherein R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

12. A compound of formula (I) according to claims 1 to 11 wherein R^b and R^c independently represent a hydrogen atom or a halogen atom.

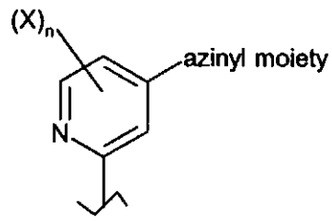
13. A compound of formula (I) according to claims 1 to 12 wherein R^d to R^i independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, tri(C_1-C_8-alkyl)silyl,

tri(C_1-C_8-alkyl)silyl-C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_2-C_8-alkenyloxy, C_2-C_8-alkynyloxy, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkoxycarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonyloxy, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, di-C_1-C_8-alkylaminocarbonyloxy, C_1-C_8-alkyloxycarbonyloxy, C_1-C_8-alkylsulphenyl, C_1-C_8-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, phenylamino, phenyl hetarylamino, or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible.

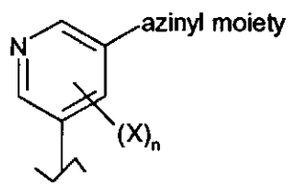
14. A compound of formula (I) according to claims 1 to 13 wherein R^d represents H, (methoxycarbonyl)amino, (4-chlorophenyl)amino, [3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]amino, (2-ethoxy-2-oxoethyl)amino, (2,2,2-trifluoroethyl)amino, (2-cyanoethyl)amino, methylamino, (2-methylpropanoyl)oxy, (3-methylbut-2-enoyl)oxy, (3-methylbutanoyl)oxy, butanoyloxy, propanoyloxy, (methoxyacetyl)oxy, acetyloxy, cyclopentyloxy, dicyclopropylmethoxy, 1-cyclopropylethoxy, but-3-yn-2-yloxy, hex-2-yn-1-yloxy, but-2-yn-1-yloxy, prop-2-yn-1-yloxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, (2,6-dichlorobenzyl)oxy, (4-chlorobenzyl)oxy, (4-methoxybenzyl)oxy, benzyloxy, cyclopropylmethoxy, 2-methylpropoxy, prop-2-en-1-yloxy, propoxy, 2-(dimethylamino)ethoxy, ethoxy, methoxy, hydroxyl, phenylamino, or phenyl hetarylamino.

15. A compound of formula (I) according to claims 1 to 14 wherein R^9 represents Hydrogen, prop-2-en-1-yl, hexyl, butyl, propyl, 2-hydroxyethyl, ethyl, methyl.

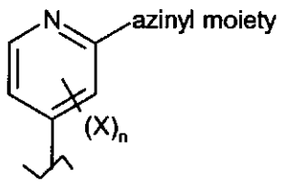
16. A compound of formula (I) according to claims 1 to 15 wherein L^1 is selected in the list consisting of :



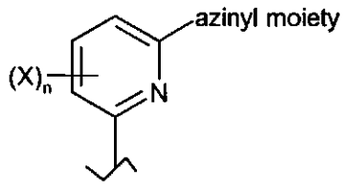
L^{1a}



L^{1b}



L^{1c}

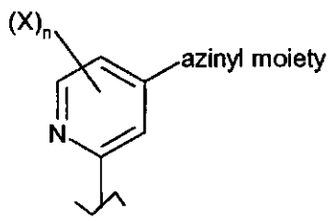


L^{1d}

wherein

- n represents 0, 1, 2 or 3;
- X independently represents a C_1-C_{10}-alkyl, a C_1-C_{10}-halogenoalkyl, a halogen atom or a cyano.

17. A compound of formula (I) according to claims 1 to 16 wherein L^1 is selected in the list consisting of :



L^{1a}

wherein

- n represents 0, 1, 2 or 3;
- X independently represents a C_1-C_{10}-alkyl, a C_1-C_{10}-halogenoalkyl, a halogen atom or a cyano.

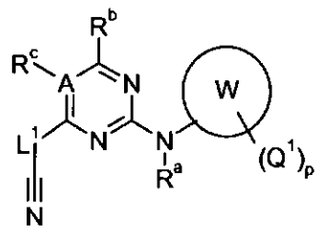
18. A compound of formula (I) according to claims 1 to 17 wherein Q^2 represents a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, (hydroxyimino)-C_1-C_6-alkyl group, C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-cycloalkyl, C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-alkylamino, di-C_1-C_8-alkylamino, C_1-C_8-alkoxy, C_1-C_8-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylsulfanyl, C_1-C_8-alkylcarbonyl, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_8-alkylcarbonylamino, C_1-C_8-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, (C_1-C_6-alkoxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkenyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (C_1-C_6-alkynyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C_1-C_8-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (benzyloxyimino)-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_8-alkoxyalkyl, C_1-C_8-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulfanyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulfanyl, phenylamino, a or a 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, or a (4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl) C1-C6-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list of consisting of N, O, S; it being possible for each of these groups or substituents to be substituted when chemically possible; or

L^2 and Q^2 form together a , 4-, 5-, 6- or 7-membered non-aromatic heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S.

19. A compound of formula (I) according to claims 1 to 18 wherein Q^2 represents (2R)-2-(methoxymethyl)pyrrolidin-1-yl, (2S)-1-methoxypropan-2-yl, 1-(diethylamino)propan-2-yl, 1-(dimethylamino)propan-2-yl, 1,1-dioxidotetrahydrothiophen-3-yl, 1,3-dimethoxypropan-2-yl, 1-cyanobutan-2-yl, 1-cyclopropyl-2-methoxyethyl, 1-

ethylpiperidin-3-yl, 1-methoxybutan-2-yl, 1-methoxypropan-2-yl, 2-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl, 2-(morpholin-4-yl)ethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2,3-dimethylpiperidin-1-yl, 2,5-dimethylpyrrolidin-1-yl, 2,6-dimethylmorpholin-4-yl, 2-cyanoethyl, 2-ethylpiperidin-1-yl, 2-hydroxy-2-methylpropyl, 2-hydroxyethyl, 2-methoxyethyl, 2-methylpiperidin-1-yl, 2-methylprop-2-en-1-yl, 2-methylpropyl, 2-methylpyrrolidin-1-yl, 3-(2-oxoazepan-1-yl)propyl, 3-(2-oxopyrrolidin-1-yl)propyl, 3-(formylamino)propyl, 3-(hydroxymethyl)piperidin-1-yl, 3,3,3-trifluoropropyl, 3,3-dimethylpiperidin-1-yl, 3,5-dimethylpiperidin-1-yl, 3,6-dihydropyridin-1(2H)-yl, 3-hydroxypiperidin-1-yl, 3-hydroxypropyl, 3-hydroxypyrrolidin-1-yl, 3-methoxybutan-2-yl, 3-methoxypiperidin-1-yl, 3-methoxypropyl, 3-methylbut-2-en-1-yl, 3-methylbutan-2-yl, 3-methylbutyl, 3-methylpiperidin-1-yl, 4-(2-oxopyrrolidin-1-yl)butyl, 4-(trifluoromethyl)piperidin-1-yl, 4-cyanopiperidin-1-yl, 4-ethoxycyclohexyl, 4-formylpiperazin-1-yl, 4-hydroxypiperidin-1-yl, 4-methoxypiperidin-1-yl, 4-methylpiperazin-1-yl, 4-methylpiperidin-1-yl, 4-oxoimidazolidin-1-yl, azepan-1-yl, butan-2-yl, butyl, cyclobutyl, cyclohexyl, cyclopentyl, cyclopropyl, cyclopropylmethyl, ethyl, hydrogen, hexyl, hydroxy, methoxy, methyl, morpholin-4-yl, oxetan-3-yl, pentan-2-yl, pentan-3-yl, pentyl, piperidin-1-yl, prop-2-en-1-yl, propan-2-yl, propyl, pyrrolidin-1-yl, tert-butyl, tetrahydrofuran-2-ylmethyl, thiomorpholin-4-yl.

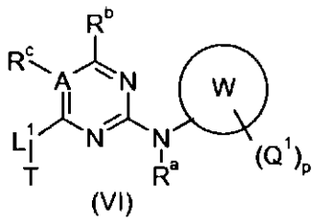
20. A compound of formula (V) useful as intermediate compound or material for the preparation of a compound of formula (I) according to claims 1 to 19



(V)

wherein W, A, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 are defined as in claims 1 to 18.

21. A compound of formula (VI) useful as intermediate compound or material for the preparation of a compound of formula (I) according to claims 1 to 19



(VI)

wherein W, A, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 are defined as in claims 1 to 18, and T represents a chlorine atom, provided that the following compounds are excluded:

- N-(3-chlorophenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine
- 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine
- 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine

22. A compound of formula (VI) according to claim 21 selected from the group constituted of 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(pyridin-3-yl)pyrimidin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-methoxypyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 3-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}benzoic acid, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(6-chloropyridin-2-yl)pyrimidin-2-amine, N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-(1-methoxybutan-2-yl)pyridine-2,4-diamine, N-(3-chloro-4-fluorophenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(methylsulfanyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, N-(3-chloro-4-methylphenyl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-cyclobutylpyridine-2,4-diamine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-(3-methylbutan-2-yl)pyridine-2,4-diamine, N^4-[4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-yl]-N^2-(pentan-3-yl)pyridine-2,4-diamine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(pyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, methyl 3-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}thiophene-2-carboxylate, ethyl 2-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}-4-methyl-1,3-thiazole-5-carboxylate, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(4-methyl-1,3-thiazol-2-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(5-methyl-1,3-thiazol-2-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(2-methylpyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, N-(2-bromopyridin-4-yl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, N-(5-bromopyridin-3-yl)-4-(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[2-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl]pyrimidin-2-amine, 2-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}thiophene-3-carbonitrile, N-(5-chloro-3-methylpyridin-2-yl)-4-(2-chloropyridin-

4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(4-chloropyridin-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(2-methylpyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)-N-(methoxymethyl)pyrimidin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(2,5-difluorophenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3-fluorophenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(methoxymethyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(thiophen-3-yl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(trifluoromethyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(propan-2-yl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(trifluoromethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3-ethoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(3-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-phenyl-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-(4-fluorophenyl)-1,3,5-triazin-2-amine, 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(difluoromethoxy)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine, N-(3-{[4-(2-chloropyridin-4-yl)-1,3,5-triazin-2-yl]amino}phenyl)acetamide, and 4-(2-chloropyridin-4-yl)-N-[3-(difluoromethyl)phenyl]-1,3,5-triazin-2-amine.

23. The use of a compound defined in claims 20 to 22 as an intermediate compound or material for the preparation of a compound of formula (I) according to claims 1 to 19.

24. A fungicide composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound according to claims 1 to 19 and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

25. 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 19 or a composition according to claim 24 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.

26. A method for combating phytopathogenic and mycotoxin producing fungi characterized in that a compound according to Claim 1 to 19 or a composition according to claim 24 is applied to these fungi and/or their habitat.

DERIVADOS DE (PIRIDIL)-AZINILAMINA SUSTITUIDOS COMO AGENTES PROTECTORES DE PLANTAS

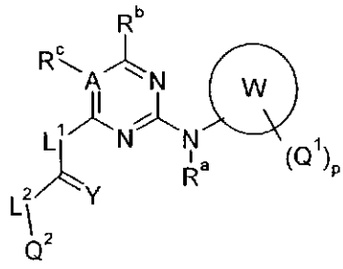
DESCRIPCIÓN

La presente invención se refiere a derivados de (piridil)-azinilamino sustituidos, a su procedimiento de preparación, a la preparación de compuestos intermedios, a su uso como agentes fungicidas activos, en particular en forma de composiciones fungicidas, y a métodos para reprimir hongos fitopatógenos, en concreto de plantas, usando estos compuestos o composiciones.

El documento WO 2007/003525 describe derivados de N-fenil-triazinilamina útiles como inhibidores de enzimas para tratar enfermedades o síntomas de enfermedades. Sin embargo, esta referencia no se refiere a aplicaciones fungicidas de dichos derivados. Además, los documentos WO 2005/019211 y WO 2005/033095 describen un método para proteger plantas frente al ataque de organismos fitopatógenos usando derivados de N-fenil-triazinilamina sustituidos con aminopiridinilo. Sin embargo, dicha estructura química de estos compuestos de la técnica anterior es diferente de la de los compuestos 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 reprimir el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos. Es también de gran interés la utilización de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con objeto de reducir las cantidades de compuesto activo que se han de utilizar, manteniendo al mismo tiempo una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos. Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o ventajas anteriormente mencionados.

Por consiguiente, la presente invención proporciona derivados de (piridil)-azinil-amino N-sustituidos de fórmula (I)



(I)

en la que

- W representa fenilo o un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- A representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno con la condición de que si A representa un átomo de carbono entonces W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5

átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alcoxialquilo C_1-C_8 o un halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxialquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxialquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- L^1 representa un resto piridilo sustituido o no sustituido;
- Y representa O, S, NR^d, CR^eR^f;
- L^2 representa un enlace directo, O, S, NR^g, CR^hR^i;

- Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6, alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_6, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consite en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la

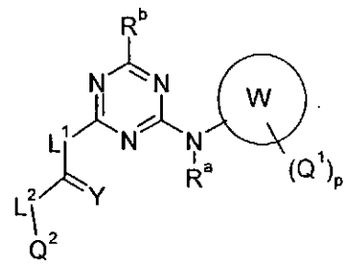
lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- Alternativamente, L^2 y Q^2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h y R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos

de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides e isómeros ópticamente activos o geométricos; con la condición de que estén excluidos los compuestos siguientes:

- (3-{[4-(2-etenilpiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}fenil)metanol;
- 4-{4-[(3-{2-[(terc-butoxicarbonil)amino]etoxi}fenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-piridina-2-carboxilato de metilo;
- N-{3-[(4-{2-[(1Z)-3-amino-2-cloroprop-1-en-1-il]piridin-4-il}-1,3,5-triazin-2-il)amino]-bencil}-N-metilglicina.
-
- En una realización particular de la invención, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que A representa un átomo de nitrógeno y W representa fenilo.
- Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la invención se representa, por lo tanto, por un compuesto de fórmula II:



(II)

en los que

- W representa fenilo
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un

alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilisulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alcoxialquilo C_1-C_8 o un halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxialquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxialquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquiltioalquil C_1-

C_8)carbonilo, un (halogenoalquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- R^b representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- L^1 representa un resto piridilo sustituido o no sustituido;
- Y representa O, S, NR^d, CR^eR^f;
- L^2 representa un enlace directo, O, S, NR^g, CR^hR^i;
- Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6, alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6-)-

(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

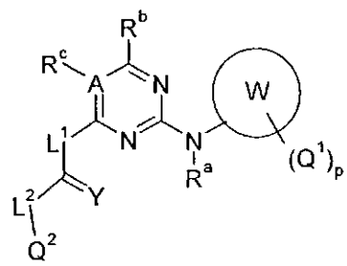
- Alternativamente, L2 y Q2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h y R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que

tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloídicos e isómeros ópticamente activos o geométricos;

En otra realización particular de la invención, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes.

Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la invención se representa, por lo tanto, por un compuesto de fórmula (III):



(III)

en los que

- W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- A representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilisulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino;

pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alcoxialquilo C_1-C_8 o un halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxialquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxialquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- L^1 representa un resto piridilo sustituido o no sustituido;
- Y representa O, S, NR^d, CR^eR^f;
- L^2 representa un enlace directo, O, S, NR^g, CR^hR^i;
- Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6, alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8,

halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

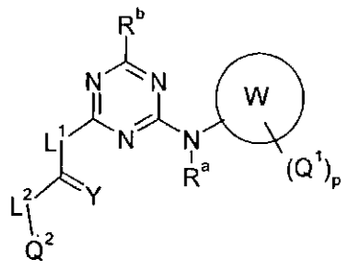
- Alternativamente, L2 y Q2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h y R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que

tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloídicos e isómeros ópticamente activos o geométricos;

En otra realización particular de la invención, los compuestos de fórmula (III) de acuerdo con la invención son aquellos en los que A representa un átomo de nitrógeno.

Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la invención se representa, por lo tanto, por un compuesto de fórmula (III_1):



(III_1)

en los que

- W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilisulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un

alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alcoxialquilo C_1-C_8 o un halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxialquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxialquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- L^1 representa un resto piridilo sustituido o no sustituido;
- Y representa O, S, NR^d, CR^eR^f;
- L^2 representa un enlace directo, O, S, NR^g, CR^hR^i;
- Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6, alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8),

halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

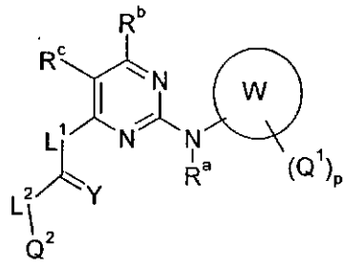
- Alternativamente, L2 y Q2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;

- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h y R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloídicos e isómeros ópticamente activos o geométricos;

En otra realización particular de la invención, los compuestos de fórmula (III) de acuerdo con la invención son aquellos en los que A representa un átomo de carbono.

Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la invención se representa, por lo tanto, por un compuesto de fórmula (III_2):



(III_2)

en los que

- W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene

de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilisulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alcoxialquilo C_1-C_8 o un halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxialquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxialquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- L^1 representa un resto piridilo sustituido o no sustituido;

- Y representa O, S, NR^d, CR^eR^f;
- L^2 representa un enlace directo, O, S, NR^g, CR^hR^i;
- Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6, alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos

seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- Alternativamente, L2 y Q2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h y R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-

(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloídicos e isómeros ópticamente activos o geométricos;

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

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

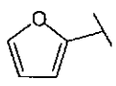
Cualquier compuesto de las fórmulas (I, II, III, III_1, III_2) de acuerdo con la invención, en las que L^2Q^2 representa un grupo hidroxi, un grupo sulfanilo o un grupo amino, puede existir en una forma tautómera que resulta del desplazamiento del protón de dicho grupo hidroxi, grupo sulfanilo o grupo amino, respectivamente. Dichas formas tautómeras forman parte asimismo de la presente invención. En general, cualquier forma tautómera de un compuesto de las fórmulas (I, II, III, III_1, III_2) de acuerdo con la invención, en las que L^2Q^2 representa un grupo hidroxi, un grupo sulfanilo o un grupo amino, así como las formas tautómeras de los compuestos de la invención que se pueden usar opcionalmente como compuestos intermedios en los procedimientos de preparación de acuerdo con la invención, también son parte de la presente invención.

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

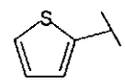
- halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo;
- heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre;
- a menos que se indique de otra manera, un grupo o un sustituyente que está sustituido según la invención puede estar sustituido con uno o más de los siguientes grupos o átomos: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino;

Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que W representa fenilo.

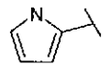
Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, seleccionado de la lista que consiste en:

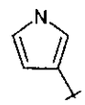

Het-1 ;

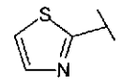

Het-2 ;

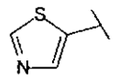

Het-3 ;


Het-4 ;

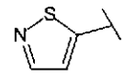

Het-5 ;

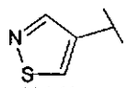

Het-6 ;

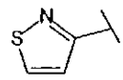

Het-7 ;

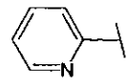

Het-8 ;

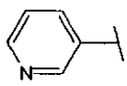

Het-9 ;

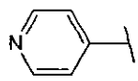

Het-10 ;


Het-11


Het-12


Het-13 ;


Het-14


Het-15 .

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que Q^1 representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5

átomos de halógeno, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible.

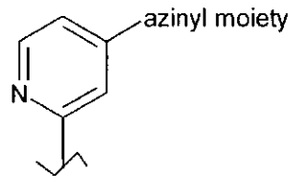
Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en la que p representa 0, 1, 2 ó 3. Más preferiblemente, p representa 0 ó 1. Aún más preferiblemente p representa 1.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que R^a representa un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en la que R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno. Más preferiblemente, R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que L^1 se selecciona de la lista que consiste en:

Los compuestos incluso más preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que L^1 representa



L^{1a}

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, cicloalquilo C_1-C_8, halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfanilo C_1-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8-alquilo), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquil C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogeno alquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

cuando L^2 y Q^2 forman juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O y S, los heterociclos resultantes

preferidos no son aromáticos. Los heterociclos más preferidos son pirolidina, piperidina, morfolina.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que de R^d a R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquiloxi C_1-C_8)carboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible.

Otros compuestos más preferidos de formula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que R^d representa H, (metoxicarbonil)amino, (4-clorofenil)amino, [3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]amino, (2-etoxi-2-oxoetil)amino, (2,2,2-trifluoroetil)amino, (2-cianoetil)amino, metilamino, (2-metilpropanoil)oxi, (3-metilbut-2-enoil)oxi, (3-metilbutanoil)oxi, butanoiloxi, propanoiloxi, (metoxiacetil)oxi, acetiloxi, ciclopentiloxi, diciclopropilmetoxi, 1-ciclopropiletoxi, but-3-in-2-iloxi, hex-2-in-1-iloxi, but-2-in-1-iloxi, prop-2-in-1-iloxi, 2,2,2-

trifluoroetoxi, (2,6-diclorobencil)oxi, (4-clorobencil)oxi, (4-metoxibencil)oxi, benciloxi, ciclopropilmetoxi, 2-metilpropoxi, prop-2-en-1-iloxi, propoxi, 2-(dimetilamino)etoxi, etoxi, metoxi, hidroxilo, feniłamino o fenilheteroarilamino.

Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que R^g representa hidrógeno, prop-2-en-1-ilo, hexilo, butilo, propilo, 2-hidroxietilo, etilo, metilo.

Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención, son aquellos en los que Q^2 representa (2R)-2-(metoximetil)pirrolidin-1-ilo, (2S)-1-metoxipropan-2-ilo, 1-(dietilamino)propan-2-ilo, 1-(dimetilamino)propan-2-ilo, 1,1-dioxidotetrahidrotiofen-3-ilo, 1,3-dimetoxipropan-2-ilo, 1-cianobutan-2-ilo, 1-ciclopropil-2-metoxietilo, 1-etilpiperidin-3-ilo, 1-metoxibutan-2-ilo, 1-metoxipropan-2-ilo, 2-(hidroximetil)piperidin-1-ilo, 2-(morfolin-4-il)etilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,3-dimetilpiperidin-1-ilo, 2,5-dimetilpirrolidin-1-ilo, 2,6-dimetilmorfolin-4-ilo, 2-cianoetilo, 2-etilpiperidin-1-ilo, 2-hidroxi-2-metilpropilo, 2-hidroxietilo, 2-metoxietilo, 2-metilpiperidin-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metilpropilo, 2-metilpirrolidin-1-ilo, 3-(2-oxoazepan-1-il)propilo, 3-(2-oxopirrolidin-1-il)propilo, 3-(formilamino)propilo, 3-(hidroximetil)piperidin-1-ilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3-dimetilpiperidin-1-ilo, 3,5-dimetilpiperidin-1-ilo, 3,6-dihidropiridin-1(2H)-ilo, 3-hidroxipiperidin-1-ilo, 3-hidroxipropilo, 3-hidroxipirrolidin-1-ilo, 3-metoxibutan-2-ilo, 3-metoxipiperidin-1-ilo, 3-metoxipropilo, 3-metilbut-2-en-1-ilo, 3-metilbutan-2-ilo, 3-metilbutilo, 3-metilpiperidin-1-ilo, 4-(2-oxopirrolidin-1-il)butilo, 4-(trifluorometil)piperidin-1-ilo, 4-cianopiperidin-1-ilo, 4-etoxiciclohexilo, 4-formilpiperazin-1-ilo, 4-hidroxipiperidin-1-ilo, 4-metoxipiperidin-1-ilo, 4-metilpiperazin-1-ilo, 4-metilpiperidin-1-ilo, 4-oxoimidazolidin-1-ilo, azepan-1-ilo, butan-2-ilo, butilo, ciclobutilo, ciclohexilo, ciclopentilo, ciclopropilo, ciclopropilmetilo, etilo, hidrógeno, hexilo, hidroxi, metoxi, metilo, morfolin-4-ilo, oxetan-3-ilo, pentan-2-ilo, pentan-3-ilo, pentilo, piperidin-1-ilo, prop-2-en-1-ilo, propan-2-ilo, propilo, pirrolidin-1-ilo, terc-butilo, tetrahidrofuran-2-ilmetilo, tiomorfolin-4-ilo.

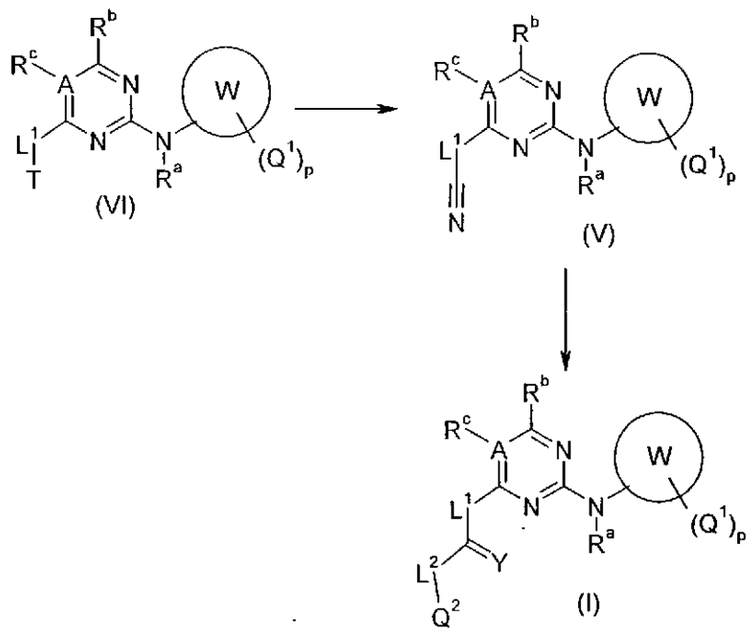
Las preferencias mencionadas anteriormente con respecto a los sustituyentes de los compuestos de fórmula (I) según la invención pueden combinarse de diversas maneras, bien individual, parcial o completamente. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan así subclases de compuestos de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

- las características preferidas de W con las características preferidas de uno o más de Q^1 y p, R^a a R^i, L^1, Y, L^2 y Q^2;
- las características preferidas de Q^1 y p con las características preferidas de uno o más de W, R^a a R^i, L^1, Y, L^2 y Q^2;
- las características preferidas de R^a a R^i con las características preferidas de uno o más de W, Q^1 y p, L^1, Y, L^2 y Q^2;
- las características preferidas de L^1 con las características preferidas de uno o más de W, Q^1 y p, R^a a R^i, Y, L^2 y Q^2;
- las características preferidas de Y con las características preferidas de uno o más de W, Q^1 y p, R^a a R^i, L^1, L^2 y Q^2;
- las características preferidas de L^2 con las características preferidas de uno o más de W, Q^1 y p, R^a a R^i, L^1, Y y Q^2;
- las características preferidas de Q^2 con las características preferidas de uno o más de W, Q^1 y p, R^a a R^i, L^1, Y y L^2.

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 W, Q^1 y p, R^a a R^i, L^1, Y, L^2 y Q^2 para formar así las subclases más preferidas de los compuestos según la invención.

Las características preferidas de los otros sustituyentes de los compuestos según la invención pueden formar parte también de dichas subclases de compuestos preferidos según la invención, en particular los grupos de sustituyentes W, Q^1 y p, R^a a R^i, L^1, Y, L^2 y Q^2.

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



Procedimiento P1

en los que

- T representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido, y
- si Y representa un átomo de oxígeno y L^2 representa CR^hR^i;
- siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1, Q^2 como se definen en esta memoria; y que comprende
  - hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI) con un reactivo de cianuro tal como un cianuro metálico, por ejemplo cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianuro de cinc; un cianuro metaloide, un cianuro organometálico, por ejemplo cianuro de di-alquil C_1-C_6-aluminio, en particular cianuro de di-etilaluminio; un cianuro organometaloídico, por ejemplo cianuro tri-(alquil C_1-C_6)sililo en particular cianuro de trimetilsililo para dar un compuesto de fórmula (V), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un

ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, fosfito de tris-(2,4-terc-butilfenilo), (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina; para dar un compuesto de fórmula (V);

- después hacer reaccionar dicho compuesto de fórmula (V) con un reactivo organometálico de fórmula Q^2-L^2-M, en la que M representa un metal tal como litio, magnesio, sodio, potasio o una sal metálica tal como sal de magnesio, sal de litio, sal de potasio o sal de sodio; para dar un compuesto de fórmula (I); opcionalmente en presencia de un catalizador;
- o haciendo reaccionar después dicho compuesto de fórmula (V) con un reactivo de iluro de fosforano de fórmula Q^2-L^2-U, en la que U representa un grupo tri-(fenil)-fosfonio, un fosfonato de di-alquilo(C_1-C_6); para dar un compuesto de fórmula (I); en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica; preferiblemente hidruros de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos, tales como hidruro de sodio, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU); opcionalmente en presencia de un catalizador;

- si Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un enlace directo y Q^2 representa un átomo de hidrógeno;
- siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria; y que comprende
    - hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI) con un reactivo de cianuro tal como un cianuro metálico, por ejemplo cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianuro de cinc; un cianuro metaloide, un cianuro organometálico, por ejemplo cianuro de di-alquil C_1-C_6-aluminio, en particular cianuro de di-etilaluminio; un cianuro organometaloídico, por ejemplo cianuro tri-(alquil C_1-C_6)sililo en particular cianuro de trimetilsililo para dar un compuesto de fórmula (V), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, fosfito de tris-(2,4-terc-butilfenilo), (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina; para dar un compuesto de fórmula (V),
    - hacer reaccionar dicho compuesto de fórmula (V) con un agente reductor tal como hidrógeno, un metal, tal como magnesio, una sal metálica tal como $SnCl_2$ o $SnBr_2$; o un donador de hidruro de fórmula H-M, en la que M representa un metal, o una sal metálica, tal como hidruros de di-(alquil C_1-C_6)aluminio, en

particular hidruro de di-etilaluminio, para dar un compuesto de fórmula (I); opcionalmente en presencia de un catalizador;

- si Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un enlace directo y Q^2 representa un átomo de hidrógeno;
- siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria; y que comprende
  - hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI) con un reactivo de cianuro tal como un cianuro metálico, por ejemplo cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianuro de cinc; un cianuro metaloide, un cianuro organometálico, por ejemplo cianuro de di-alquil C_1-C_6-aluminio, en particular cianuro de di-etilaluminio; un cianuro organometaloídico, por ejemplo cianuro tri-(alquil C_1-C_6)sililo en particular cianuro de trimetilsililo para dar un compuesto de fórmula (V), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, fosfito de tris-(2,4-terc-butilfenilo), (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina; para dar un compuesto de fórmula (V),
  - hidrolizar dicho compuesto de fórmula (V), preferiblemente en presencia de agua, opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica o

una orgánica; preferiblemente un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU); opcionalmente en presencia de ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; principalmente un ácido mineral tal como ácido sulfúrico ácido, ácido clorhídrico, o un ácido orgánico, tal como el ácido para-toluenosulfónico; para dar un compuesto de fórmula (I);

- si Y representa NH, L^2 representa un enlace directo, un átomo de azufre, un átomo de oxígeno o NH, y Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquil C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquiloxi C_1-C_8)carboniloxi, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-

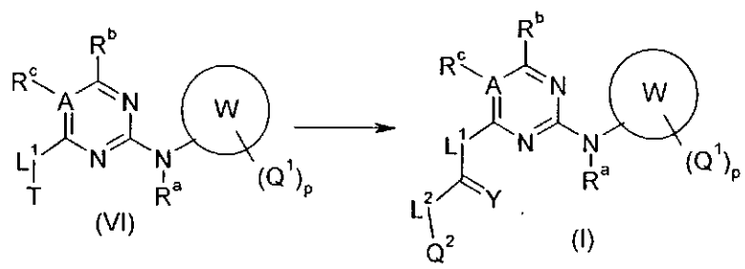
oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilamino, fenoxi o fenilamino;

- siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria; y que comprende
  - hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI) con un reactivo de cianuro tal como un cianuro metálico, por ejemplo cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianuro de cinc; un cianuro metaloide, un cianuro organometálico, por ejemplo cianuro de di-alquil C_1-C_6-aluminio, en particular cianuro de di-etilaluminio; un cianuro organometaloídico, por ejemplo cianuro tri-(alquil C_1-C_6)sililo, en particular cianuro de trimetilsililo para dar un compuesto de fórmula (V), opcionalmente en presencia de un catalizador, en particular un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, fosfito de tris-(2,4-terc-butilfenilo), (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina; para dar un compuesto de fórmula (V),
  - llevar a cabo la reacción de adición de un compuesto de fórmula (V) con un reactivo de fórmula Q^2-L^2-H, opcionalmente en presencia de una base tal como

una base inorgánica o una orgánica; preferiblemente un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU); opcionalmente en presencia de ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético, ácido para-toluenosulfónico; opcionalmente en presencia de un catalizador, para dar un compuesto de fórmula (I).

De manera ventajosa, el procedimiento P1 según la invención puede simplificarse, permitiendo la preparación directa de determinados compuestos de fórmula (I) a partir de un compuesto de fórmula (VI).

Por consiguiente, la presente invención proporciona el procedimiento P1A mejorado para la preparación de un compuesto de fórmula (I), como se ilustra mediante el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P1A

en los que

- T representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido, y
- Si Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un átomo de oxígeno, un grupo NR^9 y R^9 representan un átomo de hidrógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil- (alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;
- siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c,L^1 y Q^2 como se definen en la presente memoria; y que comprende
    - hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI) con un compuesto de fórmula Q^2-L^2-H, en la que Q^2 es como se define en esta memoria y L^2 representa un átomo de oxígeno, un grupo NR^9 y R^9 representan un átomo de hidrógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino,

alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; en presencia de monóxido de carbono o de un agente que genera monóxido de carbono tal como $Mo(CO)_6$ o $W(CO)_6$, opcionalmente en presencia de un catalizador, en particular un catalizador de un metal de transición, tales como las sales de paladio o los complejos por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfina)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-

)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina, opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica u orgánica; preferiblemente un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), para dar un compuesto de fórmula (I).

El procedimiento según la invención también permite la preparación de compuesto de fórmula (I) según la invención utilizando otros compuestos de fórmula (I) según la invención como material de partida.

Por lo tanto, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P2 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo NR^d, L^2 representa CR^hR^i; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, R^h, R^i, L^1, Q^2 como se definen en esta memoria;

que comprende hacer reaccionar un compuesto diferente de fórmula (I) en la que Y representa un átomo de oxígeno y L^2 representa CR^hR^i; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1, Q^2 como se definen en esta memoria;

con un compuesto de fórmula R^dNH o una de sus sales, en la que R^d es como se define en la presente memoria, opcionalmente en presencia de un agente deshidratante tal como tamices moleculares, sales anhidras de metales, tales como sulfato de magnesio, sulfato sódico u óxidos metálicos tales como óxido de bario, óxido de calcio, opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica o orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato

de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético y ácido para-toluenosulfónico.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P3 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo CR^eR^f, L^2 representa un átomo de oxígeno y Q^2 representa un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil-sulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1 como se definen en esta memoria;
que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente, en el que Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa CR^hR^i y Q^2 representa un átomo de hidrógeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^h, R^i, L^1 como se definen en esta memoria;

con un compuesto de fórmula Q^2T en el que T representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6 y Q^2 representa un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_5)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica; preferiblemente un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU).

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P4 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo NR^d, L^2 representa un enlace directo y Q^2 representa un átomo de hidrógeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 como se definen en la presente memoria;

y que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente, en el que Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un enlace directo y Q^2 representa un átomo de hidrógeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria;

con un compuesto de fórmula R^dNH o una de sus sales, siendo R^d como se define en la presente memoria, opcionalmente en presencia de un agente deshidratante tal como tamices moleculares, sales anhidras de metales, tales como sulfato de magnesio, sulfato sódico u óxidos metálicos tales como óxido de bario, óxido de calcio, opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica o orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético y ácido para-toluenosulfónico.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P5 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo CR^eR^f, L^2 representa un enlace directo y Q^2 representa un átomo de hidrógeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria;

y que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente, en el que Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un enlace directo y Q^2 representa un átomo de hidrógeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria;

con un compuesto de fórmula $CHUR^eR^f$, en la que U representa un átomo de hidrógeno, un grupo fosfonio, un fosfonato de di-alquil (C_1-C_6), siendo R^e, R^f como se definen en la presente memoria, o una de sus sales, un tri-alquil (C_1-C_6)-sililo, opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica u orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales

como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético y ácido para-toluenosulfónico.

Según un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P6 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo CR^eR^f, L^2 representa CR^hR^i y siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^e,R^f, R^h, R^i, L^1, Q^2 como se definen en la presente memoria;

y que comprende hacer reaccionar un compuesto diferente de fórmula (I) en la que Y representa un átomo de oxígeno y L^2 representa CR^hR^i; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^e, R^f, R^h, R^i, L^1, Q^2 como se definen en esta memoria;

con un compuesto de fórmula $CHUR^eR^f$, en la que U representa un átomo de hidrógeno, un grupo tri-(fenil)-fosfonio, un fosfonato de di-alquil (C_1-C_6), siendo R^e, R^f como se ha definido en la presente memoria, o una de sus sales, un tri-alquil (C_1-C_6)-sililo, opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica u orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como

tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético y ácido para-toluenosulfónico.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P7 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo NR^d, L^2 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR^9 en el que R^9 representa un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4

heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; Q^2 representa un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; y siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 como se definen en la presente memoria;

y que comprende hacer reaccionar un compuesto diferente de fórmula (I) en la que Y representa un grupo NR^d, L^2 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR^9 en el que R^9 representa un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de

halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; Q^2 representa un átomo de hidrogeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 como se definen en la presente memoria;

con un compuesto de fórmula Q^2T en el que T representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6 y Q^2 representa un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida

de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro de amonio, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como ácido acético, ácido para-toluenosulfónico, opcionalmente en presencia de un agente de condensación tal como el formador de haluro de ácido, en particular fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; tal como un formador de anhídrido, en particular cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo, cloruro de 2,2-dimetilpropionilo o cloruro de metanosulfonilo; en particular carbodiimidas, tal como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) o tales como otros agentes de condensación habituales, en particular pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio, opcionalmente en presencia de un catalizador en particular un catalizador de metal de transición, tales como sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)paladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-

(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P8 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo NR^d en el que R^d representa un grupo formiloxi, un grupo formilamino, alquilamino C_1-C_8, cicloalquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquilamino C_1-C_8)carboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquiloxi C_1-C_8)carboniloxi, (alcoxi C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxi C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; L^2 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR^g; Q^2 representa un átomo de hidrogeno; y siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g, L^1 como se definen en la presente memoria;

y que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente en la que Y representa un grupo NR^d en el que R^d representa un grupo amino, un grupo hidroxi, alquilamino C_1-C_8, cicloalquilamino C_1-C_8, L^2 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR^g; Q^2 representa un átomo de hidrogeno; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g, L^1 como se definen en la presente memoria;

con un compuesto de fórmula Q^2T en la que T representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6 y Q^2 representa un grupo formilo, cicloalquilo C_1-C_8, halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, halogenoalquenilo C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenoalquinilo C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de

potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro de amonio, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como ácido acético, ácido para-toluenosulfónico, opcionalmente en presencia de un agente de condensación tal como el formador de haluro de ácido, en particular fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; tal como un formador de anhídrido, en especial cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo, cloruro de 2,2-dimetilpropionilo o cloruro de metanosulfonilo; en particular carbodiimidas, tal como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) o tales como otros agentes de condensación habituales, en particular pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio, opcionalmente en presencia de un catalizador en particular un catalizador de metal de transición, tales como sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)paladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-

(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P9 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un átomo de oxígeno, un grupo NR^g; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^g, L^1, Q^2, como se definen en esta memoria;
y que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente, en la que Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un átomo de oxígeno y Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, como se definen en esta memoria;
con un compuesto de fórmula Q^2L^2H en la que Q^2 es como se define en la presente memoria y L^2 representa un átomo de oxígeno, un grupo NR^g,
opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio,

carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro de amonio, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como ácido acético, ácido para-toluenosulfónico, opcionalmente en presencia de un agente de condensación tal como el formador de haluro de ácido, en particular fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; tal como un formador de anhídrido, en especial cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo, cloruro de 2,2-dimetilpropionilo o cloruro de metanosulfonilo; en particular carbodiimidas, tal como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) o tales como otros agentes de condensación habituales, en particular pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio, opcionalmente en presencia de un catalizador en particular un catalizador de metal de transición, tales como sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)paladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, fosfito de tris-(2,4-terc-butilfenilo), (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina; en condiciones en un solo matraz o diferentes matraces.

Según la presente invención, los compuestos de fórmula (I) útiles como material de partida en los procedimientos P2 a P9, pueden prepararse según el procedimiento P1 según la invención.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P10 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un átomo de azufre, L^2 representa un átomo de oxígeno, un grupo NR^9, y siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^9, L^1 y Q^2 como se definen en esta memoria;
y que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente en la que Y representa un átomo de oxígeno, L^2 representa un átomo de oxígeno y siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^9, L^1 y Q^2 como se definen en esta memoria;
con un agente de tiocarbonilación tal como 2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano, pentasulfuro de fósforo, azufre.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P11 para preparar un compuesto de fórmula (I) en la que Y representa un grupo NR_d o un átomo de oxígeno, L^2 representa un grupo NR^9 y R^9 representa un átomo de hidrógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C^1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta

4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d , L^1, Q^2, como se definen en esta memoria;

y que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) diferente, en la que Y representa un grupo NR^d y un átomo de oxígeno, L^2 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre; Q^2 representa un grupo formilo, cicloalquilo C_1-C_8, halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, halogenoalquenilo C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenoalquinilo C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonil que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y siendo A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, R^d, L^1 como se definen en esta memoria;

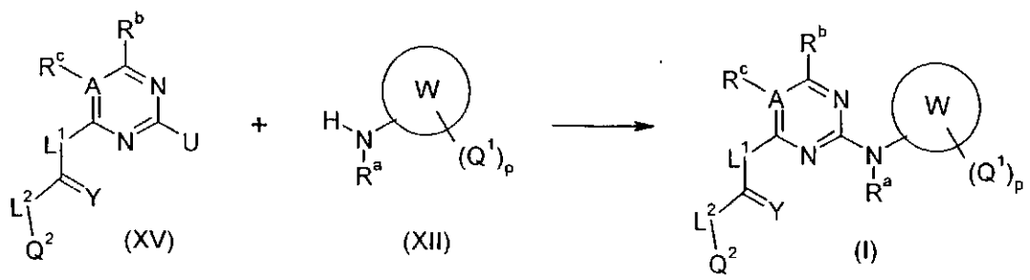
con un compuesto de fórmula R^9NH en la que R^9 es como se define en la presente memoria;

opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica; en particular un hidruro, hidróxido, amida, alcoholato, acetato, carbonato o bicarbonato de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro de amonio, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como ácido acético, ácido para-toluenosulfónico, opcionalmente en presencia de un agente de condensación tal como el formador de haluro de ácido, en particular fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; tal como un formador de anhídrido, en especial cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo, cloruro de 2,2-dimetilpropionilo o cloruro de metanosulfonilo; en particular carbodiimidas, tal como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) o tales como otros agentes de condensación habituales, en particular pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-

carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio, opcionalmente en presencia de un catalizador en particular un catalizador de metal de transición, tales como sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)paladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, fosfito de tris-(2,4-terc-butilfenilo), (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina; en condiciones en un solo matraz o diferentes matraces.

Según la presente invención, los compuestos de fórmula (I) útiles como material de partida dentro de los procedimientos P10 a P11 pueden prepararse según los procedimientos P1 a P9 según la invención.

Por lo tanto, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P12 para preparar un compuesto de fórmula (I), como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



en los que

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, Y, L^2, Q^2 son como se definen en esta memoria;

- U representa un átomo de hidrógeno o un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfenilo C_1-C_6, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_6; un fenilsulfenilo sustituido o no sustituido, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6; a fenilsulfonato sustituido o no sustituido, y que comprende

hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XV) con un derivado amino de fórmula (XII) con el fin de dar un compuesto de fórmula (I), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio(II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como una alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfina)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina, opcionalmente en presencia de reactivo organometálico tal como un reactivo organolítico, por ejemplo *n*-butil-litio, metil-litio, fenil-litio o un reactivo de haluro organomagnésico (reactivo de Grignard) tal como haluro de isopropilmagnesio, más preferiblemente tal como cloruro de isopropilmagnesio, opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica o una orgánica, preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metal alcalino o metal alcalinotérreo, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, cloruro de 2,2,6,6-tetrametilpiperidilmagnesio, hexametildisilazida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido sódico, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciaria, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-

metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de una sal metálica tal como una sal de metal alcalinotérreo, una sal de metal alcalino, una sal de metal de transición, tal como una sal de litio, preferiblemente un haluro de litio, más preferiblemente cloruro de litio, tal como una sal de cobre, preferiblemente una sal de cobre(I) tal como cloruro de cobre(I), cianuro de cobre(I), en presencia de un agente oxidante tal como oxígeno, 3,3',5,5'-tetra-terc-butildifenoquinona, 2,3-dicloro-5,6-diciano-1,4-benzoquinona (DDQ), y 2,3,5,6-tetracloro-1,4-benzoquinona (cloranilo), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético y ácido para-toluenosulfónico.

Los disolventes adecuados para llevar a cabo los procedimientos P1 a P12 según la invención son en cada caso todos los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-t-butílico, éter metil-t-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida hexametilfosfórica; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo o sulfonas, tales como sulfolano.

Cuando se llevan a cabo los procedimientos P1 a P12 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar independientemente dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, los procedimientos de acuerdo con la invención se realizan a temperaturas comprendidas entre -80°C y 250°C.

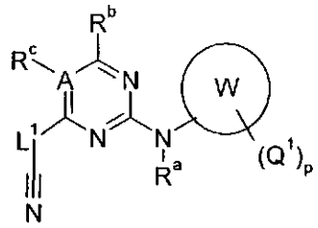
Los procedimientos P1 a P12 según la invención se llevan a cabo en general independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, en cada caso, es también posible trabajar a presión elevada o reducida.

El tratamiento se realiza por métodos habituales. De manera general, la mezcla de reacción se trata con agua y la fase orgánica se separa y, después de secar, se concentra a presión reducida. Si fuera apropiado, el residuo restante se puede liberar por los métodos convencionales, tal como por cromatografía o recristalización, de cualquier impureza que todavía pueda estar presente.

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

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

La presente invención de este modo proporciona compuesto de fórmula (V)

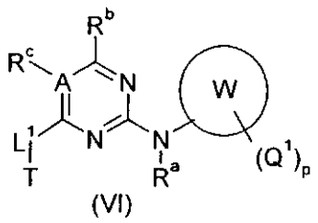


(V)

en la que A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c y L^1, son como se definen en esta memoria.

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

La presente invención de este modo proporciona compuestos de fórmula (VI)



(VI)

en la que W, A, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, y T son como se definen en esta memoria, con la condición de que se excluyan los siguientes compuestos:

- N-(3-clorofenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina
- 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina
- 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3,4,5-trimetoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina

Los compuestos de fórmula (VI) preferidos de acuerdo con la invención, son aquellos en los que T es un átomo de cloro.

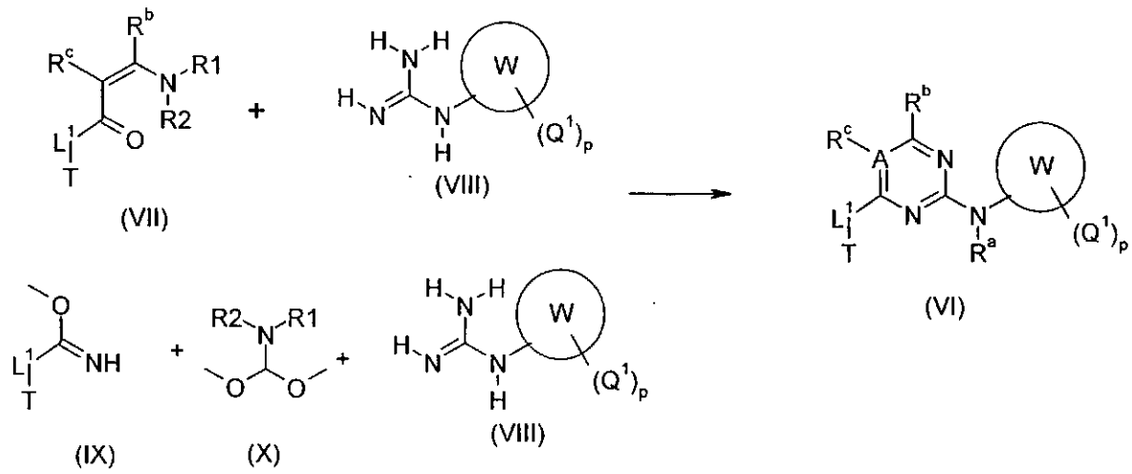
Los compuestos de fórmula (VI) más preferidos de acuerdo con la invención, son los seleccionados del grupo que consiste en 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(piridin-3-il)pirimidin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-metoxipiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3,4,5-trimetoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina, ácido 3-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}benzoico, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-cloropiridin-2-il)pirimidin-2-amina, N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-(1-metoxibutan-2-il)piridina-2,4-diamina, N-(3-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(metilsulfanil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, N-(3-cloro-4-metilfenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-ciclobutilpiridina-2,4-diamina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-(3-metilbutan-2-il)piridina-2,4-diamina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-(pentan-3-il)piridina-2,4-diamina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(piridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 3-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}tiofeno-2-carboxilato de metilo, 2-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}-4-metil-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(4-metil-1,3-tiazol-2-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(5-metil-1,3-tiazol-2-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(2-metilpiridin-4-il)pirimidin-2-amina, N-(2-bromopiridin-4-il)-4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina, N-(5-bromopiridin-3-il)-4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[2-(trifluorometil)piridin-4-il]pirimidin-2-amina, 2-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}tiofeno-3-carbonitrilo, N-(5-cloro-3-metilpiridin-2-il)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(4-cloropiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(2-metilpiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)-N-(metoximetil)pirimidin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(2,5-difluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3-fluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(metoximetil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(tiofen-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(trifluorometil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(propan-2-il)fenil]-1,3,5-

triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(trifluorometoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3-etoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3-metoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-fenil-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(4-fluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(difluorometoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, N-(3-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}fenil)acetamida y 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(difluorometil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(difluorometil)-4-fluorofenil]-1,3,5-triazin-2-amina y N-[4-cloro-3-(difluorometil)fenil]-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina

Los compuestos de fórmula (VI) útiles como productos intermedios para el procedimiento de preparación de los compuestos de fórmula (I) o fórmula (V), se pueden preparar por diferentes procedimientos. Por consiguiente, se proporciona un procedimiento A de acuerdo con la invención para preparar un compuesto de fórmula (VI) en la que

- R^a representa un átomo de hidrogeno;
- siendo A, W, Q^1, p, R^b, R^c, L^1, T como se definen en esta memoria; y que comprende

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



Esquema A-1:

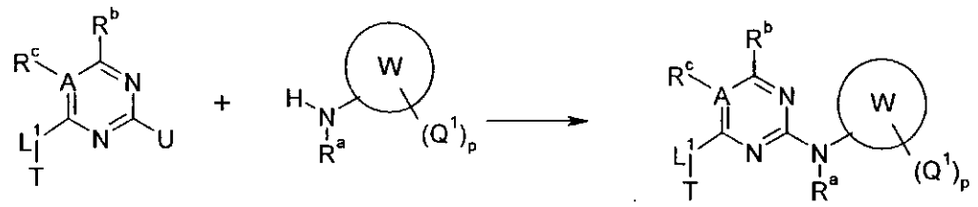
en los que

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T son como se definen en esta memoria;
- R^1 y R^2 son independientemente un grupo alquilo C_1-C_8, R^1 y R^2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;

que comprende la formación del resto pirimidina o triazina por condensación, a una temperatura de -50°C a 200°C, de un compuesto de fórmula (VII) o fórmula (IX), en presencia de un compuesto de fórmula (X), opcionalmente en presencia de una base tal como una base inorgánica o una orgánica, preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metal alcalinotérreo o metal alcalino, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU); con un derivado de guanidina o de una sal de guanidina de fórmula (VIII) para dar un compuesto de fórmula (VI).

Alternativamente, se proporciona un procedimiento B de acuerdo con la invención para preparar un compuesto de fórmula (VI) en la que A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T son como se definen en esta memoria; y que comprende

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



(XI) (XII) (VI)

Esquema B-1

en los que

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T son como se definen en esta memoria;
- U representa un átomo de hidrógeno o un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfenilo C_1-C_6, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_6; un fenilsulfenilo sustituido o no sustituido, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6; a fenilsulfonato sustituido o no sustituido, y que comprende

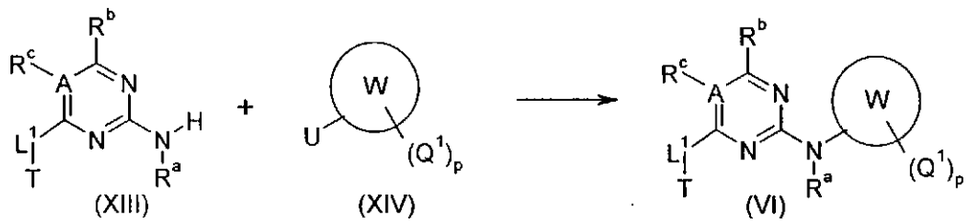
hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XI) con un derivado amino de fórmula (XII) con el fin de dar un compuesto de fórmula (VI), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de

paladio, por ejemplo cloruro de paladio (II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como una alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfina)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina, opcionalmente en presencia de reactivo organometálico tal como un reactivo organolítico, por ejemplo *n*-butil-litio, metil-litio, fenil-litio o un reactivo de haluro organomagnésico (reactivo de Grignard) tal como haluro de isopropilmagnesio, más preferiblemente tal como cloruro de isopropilmagnesio, opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica o una orgánica, preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metal alcalino o metal alcalinotérreo, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, cloruro de 2,2,6,6-tetrametilpiperidilmagnesio, hexametildisilazida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido sódico, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciaria, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de una sal metálica tal como una sal de metal alcalinotérreo, una sal de metal alcalino, una sal de metal de transición, tal como una sal de litio, preferiblemente un haluro de litio, más preferiblemente cloruro de litio, tal como una sal de cobre, preferiblemente una sal de cobre(I) tal como cloruro de cobre(I), cianuro de cobre(I), en presencia de un agente oxidante tal como oxígeno, 3,3',5,5'-tetra-terc-butildifenoquinona, 2,3-dicloro-5,6-diciano-1,4-benzoquinona (DDQ), y 2,3,5,6-tetracloro-1,4-

benzoquinona (cloranilo), opcionalmente en presencia de un ácido tal como un ácido de Lewis; en particular haluros metálicos o metaloídicos tales como tricloruro de aluminio, dicloruro de cinc, bromuro de magnesio, tribromuro de boro; o tales como un ácido de Brönstedt; en particular un ácido mineral tal como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, cloruro amónico, ácido fosfórico o un ácido orgánico, tal como el ácido acético y ácido para-toluenosulfónico.

Alternativamente, se proporciona un procedimiento C de acuerdo con la invención para preparar un compuesto de fórmula (VI) en la que A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T son como se definen en esta memoria; y que comprende

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



Esquema C-1

en los que

- A, W, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1, T son como se definen en esta memoria;
- U representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquilsulfenilo C_1-C_6, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_6; un fenilsulfenilo sustituido o no sustituido, un alquilsulfonato C_1-C_6, un halogenoalquilsulfonato C_1-C_6; a fenilsulfonato sustituido o no sustituido, y que comprende

hacer reaccionar un derivado amino de fórmula (XIII) con un compuesto de fórmula (XIV) con el fin de dar un compuesto de fórmula (VI), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio (II), acetato de paladio(II), tetrakis-(trifenilfosfina)paladio(0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina)paladio(II), tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio(II). Como una alternativa, el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfina)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sodio, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-

binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina, opcionalmente en presencia de un reactivo organometálico tal como un reactivo organolítico por ejemplo *n*-butil-litio, metil-litio, fenil-litio o un reactivo de haluro organomagnésico (reactivo de Grignard) tal como haluro de isopropil magnesio, por ejemplo cloruro de isopropilmagnesio, opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica o una orgánica; preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos o metales alcalinos, tal como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, cloruro de 2,2,6,6-tetrametilpiperidilmagnesio, hexametildisilazida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio o carbonato de amonio; y también aminas terciaria, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de una sal metálica tal como una sal de metal alcalinotérreo, una sal de metal alcalino, una sal de metal de transición tal como una sal de litio, preferiblemente un haluro de litio, más preferiblemente cloruro de litio, tal como una sal de cobre, preferiblemente una sal de cobre(I) tal como cloruro de cobre(I), cianuro de cobre(I), en presencia de un agente oxidante tal como oxígeno, 3,3',5,5'-tetra-terc-butildifenoquinona, 2,3-dicloro-5,6-diciano-1,4-benzoquinona (DDQ), y 2,3,5,6-tetracloro-1,4-benzoquinona (cloranilo).

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" significa una cantidad de composición según la invención que es suficiente para combatir o destruir los hongos presentes o susceptibles de aparecer en los cultivos y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo dependiendo del hongo que

se va a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida según la invención. Esta cantidad se puede determinar por ensayos de campo sistemáticos, que están dentro de las capacidades de un experto en la técnica.

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.

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

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

Opcionalmente, también pueden incluirse otros componentes, por ejemplo, coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizadores y agentes

secuestrantes. Más generalmente, los compuestos activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido, que se adapte a las técnicas convencionales de formulación.

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

Las composiciones según la presente invención se pueden usar en diversas formas tales como dispensador de aerosol, suspensión en cápsulas, concentrado para fumigación en frío, polvo fino 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, bastoncillos, 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), liquido 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 solubles en agua, polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humectable Estas composiciones incluyen no sólo las composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla que se va a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de atomización o de pulverización, sino también las composiciones comerciales concentradas que deben diluirse antes de la aplicación al cultivo.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden mezclarse también con una o más sustancias activas insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen normalmente un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros compuestos fungicidas son particularmente ventajosas.

Los ejemplos de fungicidas acompañantes de la mezcla adecuados pueden seleccionarse de las siguientes listas:

(1) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo y ácido oxolínico.

(2) Inhibidores de la mitosis y división celular, por ejemplo benomilo, carbendazim, clorfenazol, dietofencarb, etaboxam, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato, tiofanato-metilo y zoxamida.

(3) Inhibidores de la respiración, por ejemplo diflumetorim como inhibidor de la respiración CI; bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanilo, fluopiram, furametpir, furmeciclox, isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), mepronilo, oxicarboxin, penflufen, pentiopirad, sedaxano, tifluzamida como inhibidor de la respiración CII; amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestroburina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, piraoxistrobina, pirametostrobina, piribencarb, trifloxistrobina como inhibidor de la respiración CIII.

(4) Compuestos capaces de actuar como un desacoplador, como por ejemplo binapacrilo, dinocap, fluazinam y meptildinocap.

(5) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina y siltiofam.

(6) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, kasugamicina, hidrocloruro de kasugamicina hidrato, mepanipirim y pirimetanil.

(7) Inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo fenpiclonilo, fludioxonil y quinoxifeno.

(8) Inhibidores de la síntesis de lípidos y de la membrana, por ejemplo bifenilo, clozolinato, edifenfos, etridiazol, iodocarb, iprobenfos, iprodiona, isoprotiolano, procimidona, propamocarb, hidrocloruro de propamocarb, pirazofos, tolclofos-metilo y vinclozolina.

(9) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo aldimorph, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorph, acetato de dodemorph, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamida, fenpropidina, fenpropimorph, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol,

ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, piperalina, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, quinconazol, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, tridemorph, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, uniconazol-p, viniconazol y voriconazol.

(10) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo bentiavalicarb, dimetomorph, flumorph, iprovalicarb, mandipropamida, polioxinas, polioxorim, protiocarb, validamicina A y valifenalato.

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

(12) Compuestos capaces de inducir una defensa del huésped, como por ejemplo acibenzolar-S-metilo, probenazol y tiadinilo.

(13) Compuestos capaces de tener una acción multisitio, como por ejemplo mezcla burdeos, captafol, captan, clorotalonilo, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxicloruro de cobre, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, sulfato de cobre, diclofluanid, ditianon, dodina, dodina base libre, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram-zinc, oxina-cobre, propamidina, propineb, azufre y preparaciones de azufre, que incluyen 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, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2E)-2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (2E)-2-{2-[({[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-iliden]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-feniletenil]oxi}fenil)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-carbotioato de O-{1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropilo}, N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N^2-(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-fosetilo, 1H-imidazol-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-iodo-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), tebufloquina, 5-metil-6-octil-3,7-dihidro[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-etil-6-octil-3,7-dihidro[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, ametoctradina, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cloroneb, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, ciprosulfamida, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, ecomato, ferimzona, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, flusulfamida, flutianilo, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, isotianilo, metasulfocarb, (2E)-2-{2-[({ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil}tio)metil]fenil}-3-metoxiacrilato de metilo, isotiocianato de metilo, metrafenona, (5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, mildiomicina, tolnifanida, 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-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, octilinona, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, ácido fenazina-1-carboxílico, fenotrina, ácido fosforoso y sus sales, fosetilato de propamocarb, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, 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, tecnazeno,

triazoxido, triclamida, 5-cloro-N'-fenil-N'-prop-2-in-1-iltiofeno-2-sulfonohidrazida, zarilamid, N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y {6-[({[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino}oxi)metil]piridin-2-il}carbamato de pentilo.

La composición de acuerdo con la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida también puede ser particularmente ventajosa. Los ejemplos de parejas de mezclas de bactericidas adecuadas pueden seleccionarse de la siguiente lista: bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

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

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

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

Entre las plantas que se pueden proteger por el método según la invención, se puede hacer mención al algodón; lino; vid; cultivos frutales o vegetales tales como *Rosaceae sp.* (por ejemplo, frutos con pepitas tales como manzanas y peras, pero también frutos con hueso tales como albaricoques, almendras y melocotones), *Ribesioidae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp.,*

Lauraceae sp., *Musaceae sp.* (por ejemplo, árbol del plátano y plataneros), *Rubiaceae sp.*, *Theaceae sp.*, *Sterculiceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae sp.* (por ejemplo, tomates), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.*, *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae sp.* (por ejemplo, fresas); grandes cultivos tales como *Graminae sp.* (por ejemplo, maíz, césped o cereales como el trigo, arroz, cebada y tritical), *Asteraceae sp.* (por ejemplo, girasol), *Cruciferae sp.* (por ejemplo, colza), *Fabaceae sp,* (por ejemplo cacahuetes), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

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

- Enfermedades por mildiú, 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 Uncínula, provocadas 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;
  Enfermedades por Phakopsora, producidas por ejemplo por Phakopsora pachyrhizi y Phakopsora meibomiae;
  Enfermedades por Puccinia, producidas por ejemplo por Puccinia recondita, Puccinia graminis o Puccinia striiformis;
  Enfermedades por Uromyces, producidas por ejemplo por Uromyces appendiculatus;
- Enfermedades por Oomycete tales como
  Enfermedades por Albugo, producidas por ejemplo por Albugo candida;
  Enfermedades por Bremia, producidas por ejemplo por Bremia lactucae;
  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 Pseudoperonspora cubensis;

Enfermedades por Pythium, producidas por ejemplo por Pythium ultimum;

- Enfermedades por manchas foliares, enrojecimientos foliares y tizón foliar tales como:

Enfermedades por Alternaria, producidas por ejemplo por Alternaria solani;

Enfermedades por Cercospora, producidas por ejemplo por Cercospora beticola;

Enfermedades por Cladiosporium, producidas por ejemplo por Cladiosporium cucumerinum;

Enfermedades por Cochliobolus, causadas por ejemplo por Cochliobolus sativus (en forma de conidio: Drechslera, Syn: Helminthosporium) o Cochliobolus miyabeanus;

Enfermedades por Colletotrichum, producidas por ejemplo por Colletotrichum lindemuthianum;

Enfermedades por Cycloconium, producidas por ejemplo por Cycloconium oleaginum;

Enfermedades por Diaporthe, producidas por ejemplo por Diaporthe citri;

Enfermedades por Elsinoe, producidas por ejemplo por Elsinoe fawcettii ;

Enfermedades por Gloeosporium, producidas por ejemplo por Gloeosporium laeticolor;

Enfermedades por Glomerella, producidas por ejemplo 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 lycopercisi;

Enfermedades por Typhula, producidas por ejemplo por Typhula incarnata;

Enfermedades por Venturia, producidas por ejemplo por Venturia inaequalis;

- Enfermedades de la raíz, vaina y tallo, tales como
  Enfermedades por Corticium, producidas por ejemplo por Corticium graminaerum;
  Enfermedades por Fusarium, producidas por ejemplo por Fusarium oxisporum;
  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 acuformis;
  Enfermedades por Thielaviopsis, producidas por ejemplo por Thielaviopsis basicola;
- Enfermedades de las espigas y panículas, que incluyen la mazorca de 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 Cladiosporium cladosporioides;
  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;
- Enfermedades por podredumbre y moho 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;
  Enfermedades por Rhizopus, producidas por ejemplo por Rhizopus stolonifer
  Enfermedades por Sclerotinia, producidas por ejemplo por Sclerotinia sclerotiorum;
  Enfermedades por Verticillium, producidas por ejemplo por Verticillium alboatrum;
- Enfermedades por putrefacción de las semillas y transmitida por el suelo, moho, marchitado, podredumbre y caída de plántulas:

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;

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; (Conidiaform: Drechslera, Bipolaris Sinónimo: Helminthosporium);

Enfermedades por Colletotrichum, producidas por ejemplo por Colletotrichum coccodes;

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;

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, provocadas por ejemplo por Phytophthora cactorum;

Enfermedades por Pyrenophora, producidas por ejemplo por Pyrenophora graminaa;

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;

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 y puntiseco tales como

Enfermedades por Nectria, producidas por ejemplo por Nectria galligena;

- Enfermedades por tizón, tales como

Enfermedades por Monilinia, producidas por ejemplo por Monilinia laxa;

- Enfermedades de sarna de la hoja y rizadura de la hoja incluyendo la deformación de flores y frutos, 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

  Enfermedades por yesca, producidas por ejemplo por Phaeomoniella clamydospora, Phaeoacremonium aleophilum y Fomitiporia mediterranea;

  Enfermedades por Ganoderma, producidas por ejemplo por Ganoderma boninense;

  Enfermedades por Rigidoporus, producidas por ejemplo por Rigidoporus lignosus

- Enfermedades de flores y semillas tales como

  Enfermedades por Botrytis, producidas por ejemplo por Botrytis cinerea;

- Enfermedades de tubérculos, tales como:

  Enfermedades por Rhizoctonia, producidas por ejemplo por Rhizoctonia solani;

  enfermedades por Helminthosporium, producidas por ejemplo por Helminthosporium solani;

- Enfermedades por hernia de las raíces de las crucíferas, tales como

  Enfermedades por Plasmodiophora, producidas por ejemplo por Plamodiophora brassicae;

- Enfermedades producidas por organismos bacterianos, tales como:

  Especies de xanthomonas, por ejemplo Xanthomonas campestris pv. oryzae;

  especies de pseudomonas, por ejemplo Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

  especies de Erwinia, por ejemplo Erwinia amylovora.

La composición fungicida de acuerdo con la invención también se puede utilizar contra enfermedades micóticas susceptibles de desarrollarse sobre maderas o en el interior de las mismas. El término "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 acorde con la invención consiste fundamentalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos acordes con la invención, o con una composición acorde con la invención; éste 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 de 10 a 800 g/ha, preferiblemente, de 50 a 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento de las hojas. La dosis de sustancia activa aplicada es general y ventajosamente de 2 a 200 g por 100 kg de semillas, preferiblemente 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 experto en la técnica sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación, en particular según la naturaleza de la planta o del cultivo a tratar.

El método de tratamiento según la invención puede utilizarse en el tratamiento de organismos modificados genéticamente (GMO), por ejemplo, plantas o semillas. Las plantas modificadas genéticamente (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado de manera estable un gen heterólogo en el genoma. La expresión "gen heterólogo" significa esencialmente un gen que se proporciona o construye fuera de la planta y que cuando se introduce en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial proporciona a la planta transformada nuevas o mejoradas propiedades agronómicas u otras propiedades mediante la expresión de una proteína o polipéptido de interés o disminuyendo o silenciando otros genes que están presentes en la planta (utilizando, por ejemplo, tecnología antisentido, tecnología de co-supresión o tecnología de interferencia de ARN – ARNi). Un gen heterólogo que está localizado en el genoma también se denomina un transgén. Un transgén que está definido por su particular localización en el genoma de la planta se denomina un evento de transformación o transgénico.

Dependiendo de la especie de planta o de la variedad de la planta cultivada, su localización y sus condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento según la invención también puede producir efectos superaditivos ("sinérgicos"). Así, por ejemplo, son posibles relaciones de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un incremento de la actividad de los compuestos y composiciones activos que pueden utilizarse según la invención, mejor crecimiento de la planta, tolerancia incrementada a temperaturas altas o bajas, tolerancia incrementada a la sequía o al agua o al contenido en sal del suelo, floración incrementada, recolección más fácil, maduración acelerada, rendimientos de cosecha mayores, frutos más grandes, mayor altura de la planta, color de la hoja más verde, floración temprana, mayor calidad y/o valor nutricional más alto de los productos cosechados, mayor concentración de azúcar en los frutos, mejor estabilidad en el almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados, lo que supera los efectos que eran de esperar.

A determinadas relaciones de aplicación, las combinaciones del compuesto activo según la invención también pueden tener un efecto reforzador en las plantas. De acuerdo con esto, también son adecuados para movilizar el sistema de defensa de la planta frente al ataque de hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados. Esta puede ser, si resulta apropiado, una de las razones de la actividad incrementada de las combinaciones según la invención, por ejemplo, frente a hongos. Debe entenderse que las sustancias que refuerzan la planta (que inducen

resistencia) significan, en el presente contexto, aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas de manera tal que cuando se inoculan posteriormente con hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados, las plantas tratadas muestran un grado de resistencia sustancial frente a esos hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos. En el caso presente, debe entenderse que los hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados significan hongos, bacterias y virus fitopatógenos. Así, las sustancias según la invención pueden utilizarse para proteger a las plantas frente al ataque de los patógenos mencionados anteriormente en un periodo de tiempo determinado después del tratamiento. El periodo de tiempo en el que se produce la protección se extiende generalmente de 1 a 10 días, preferiblemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los compuestos activos.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que se tratan preferiblemente según la invención incluyen todas las plantas que tienen material genético que proporciona características particularmente ventajosas y útiles a estas plantas (ya sean obtenidas por reproducción y/o por medios biotecnológicos).

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que preferiblemente se tratan según la invención son resistentes frente a uno o más los estrés bióticos, es decir, dichas plantas muestran una mejor defensa frente a plagas animales y microbianas, tales como frente a nematodos, ácaros, hongos, bacterias virus y/o viroides fitopatógenos.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que también pueden tratarse según la invención son aquellas plantas que son resistentes a uno o más de los estrés abióticos. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a bajas temperaturas, exposición al calor, estrés osmótico, inundación, salinidad del suelo incrementada, exposición a minerales incrementada, exposición a ozono, exposición a mucha luz, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo, falta de sombra.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que también pueden tratarse según la invención, son aquellas plantas caracterizadas por unas características de rendimiento incrementadas. El rendimiento incrementado en dichas plantas puede ser el resultado, por ejemplo, de una mejora de la fisiología de la planta, crecimiento y desarrollo, tal como eficacia en la utilización del agua, eficacia en la retención del agua, utilización mejorada del nitrógeno, asimilación incrementada del carbono, fotosíntesis mejorada, eficacia incrementada de la

germinación y maduración acelerada. El rendimiento puede verse afectado además por una arquitectura mejorada de la planta (en condiciones de estrés y sin estrés), incluyendo, pero sin limitarse a, floración temprana, control de la floración para la producción de semillas híbridas, vigor de la siembra, tamaño de la planta, número y distancia de los entrenudos, crecimiento de la raíz, tamaño de la semilla, tamaño del fruto, tamaño de la vaina, número de vainas o espigas, número de semillas por vaina o espiga, masa de semillas, relleno incrementado de las semillas, dispersión reducida de las semillas, dehiscencia reducida de la vaina y resistencia a la caída. Las características de rendimiento adicionales incluyen composición de las semillas, tales como contenido en carbohidratos, contenido en proteínas, contenido en aceite y composición, valor nutricional, reducción de compuestos anti-nutricionales, procesabilidad mejorada y mejor estabilidad en el almacenamiento.

Las plantas que pueden tratarse según la invención son plantas híbridas que expresan la característica de heterosis o vigor del híbrido que resulta generalmente en un mayor rendimiento, vigor, salud y resistencia frente a factores de estrés biótico y abiótico. Dichas plantas se obtienen típicamente cruzando una línea parental macho estéril endogámica (la hembra parental) con otra línea parental macho fértil endogámica (el macho parental). La semilla híbrida se cosecha típicamente a partir de las plantas macho estériles y se vende a los cultivadores. Las plantas macho estériles pueden producirse a veces (por ejemplo, en maíz) por castración, es decir, por la eliminación mecánica de los órganos reproductores masculinos (o flores macho) pero, típicamente, la esterilidad de los machos es el resultado de determinantes genéticos en el genoma de la planta. En este caso, y en particular cuando la semilla es el producto deseado para ser cosechado de las plantas híbridas es típicamente útil asegurar que se ha restaurado completamente la fertilidad de los machos en las plantas híbridas. Esto puede conseguirse asegurando que los machos parentales tienen los genes de restauración de la fertilidad apropiados que son capaces de restaurar la fertilidad de los machos en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad de los machos. Los determinantes genéticos para la esterilidad de los machos pueden estar localizados en el citoplasma. Los ejemplos de esterilidad masculina citoplásmica (CMS) se describieron, por ejemplo, en especies de Brassica (W0 1992/005251, WO 1995/009910, WO 1998/27806, WO 2005/002324, WO 2006/021972 y US 6.229.072). Sin embargo, los determinantes genéticos para la esterilidad de los machos también pueden estar localizados en el genoma nuclear. Las plantas macho estériles también pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética. Un medio particularmente útil para obtener plantas macho estériles se describe en WO 1989/10396 en el

que, por ejemplo, una ribonucleasa tal como barnasa se expresa selectivamente en las células del tapetum en los estambres. La fertilidad puede restaurarse entonces mediante la expresión en las células del tapetum de un inhibidor de ribonucleasa tal como barstar (por ejemplo, WO 1991/002069).

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que pueden tratarse según la invención son plantas tolerantes a los herbicidas, es decir, plantas que se han hecho tolerantes a uno o más herbicidas dados. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha tolerancia a herbicidas.

Las plantas tolerantes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato, es decir, plantas que se han hecho tolerantes al herbicida glifosato o a las sales de éste. Las plantas pueden hacerse tolerantes a glifosato mediante diferentes medios. Por ejemplo, las plantas tolerantes a glifosato pueden obtenerse mediante la transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS). Los ejemplos de dichos genes EPSPS son el gen AroA (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium* (Comai et al., Science (1983), 221, 370-371), el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.* (Barry et al., Curr. Topics Plant Physiol. (1992), 7, 139-145), los genes que codifican una EPSPS de Petunia (Shah et al., Science (1986), 233, 478-481), una EPSPS de Tomate (Gasser et al., J. Biol. Chem. (1988),263, 4280-4289), o una EPSPS de Eleusina (documento WO 2001/66704). También puede ser una EPSPS mutada como se describe, por ejemplo, en los documentos EP-A 0837944, WO 2000/066746, WO 2000/066747 o WO 2002/026995. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato óxido-reductasa como se describe en los documentos US 5.776.760 y US 5.463.175. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato acetil tranferasa como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2002/036782, WO 2003/092360, WO 2005/012515 y WO 2007/024782. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la selección de plantas que contienen mutaciones naturales de los genes mencionados anteriormente, como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2001/024615 o WO 2003/013226.

Otras plantas resistentes a herbicidas son, por ejemplo, las plantas que se hacen tolerantes a herbicidas mediante la inhibición de la enzima glutamina sintasa, tal como bialafos, fosfinotricin o glufosinato. Dichas plantas pueden obtenerse mediante la expresión de una enzima que

destoxifica el herbicida o una enzima glutamina sintasa mutante que es resistente a la inhibición. Una de dichas enzimas destoxificantes eficaces es una enzima que codifica una fosfinotricin acetiltransferasa (tal como la proteína bar o pat de especies de Streptomyces). Las plantas que expresan una fosfinotricin acetiltransferasa exógena se describen, por ejemplo, en los documentos US 5.561.236; US 5.648.477; US 5.646.024; US 5.273.894; US 5.637.489; US 5.276.268; US 5.739.082; US 5.908.810 y US 7.112.665.

Las plantas tolerantes a herbicidas adicionales también son plantas que se hacen tolerantes a los herbicidas mediante la inhibición de la enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que el para-hidroxifenilpiruvato (HPP) se transforma en homogentisato. Las plantas tolerantes a inhibidores de HPPD pueden transformarse con un gen que codifica una enzima HPPD resistente natural, o un gen que codifica una enzima HPPD mutada como se describe en WO 1996/038567, WO 1999/024585 y WO 1999/024586. La tolerancia a inhibidores de HPPD también puede obtenerse mediante la transformación de plantas con genes que codifican determinadas enzimas que permiten la formación de homogentisato a pesar de la inhibición de la enzima HPPD nativa por el inhibidor de HPPD. Dichas plantas y genes se describen en WO 1999/034008 y WO 2002/36787. La tolerancia de las plantas a inhibidores de HPPD también puede mejorarse mediante la transformación de plantas con un gen que codifica una enzima prefenato deshidrogenasa además de un gen que codifica una enzima tolerante a HPPD, como se describe en WO 2004/024928.

Aún más, las plantas tolerantes a herbicidas son plantas que se hacen tolerantes a inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS). Los inhibidores de ALS conocidos incluyen, por ejemplo, los herbicidas de tipo sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos, y/o sulfonilaminocarboniltriazolinona. Se sabe que diferentes mutaciones en la enzima ALS (también conocida como acetohidroxiácido sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas y grupos de herbicidas, como se describe, por ejemplo, en Tranel y Wright, *Weed Science* (2002), 50, 700-712, y también en los documentos US 5.605.011, US 5.378.824, US 5.141.870 y US 5.013.659. La producción de plantas tolerantes a sulfonilurea y de plantas tolerantes a imidazolinona se describe en los documentos US 5.605.011; US 5.013.659; US 5.141.870; US 5.767.361; US 5.731.180; US 5.304.732; US 4.761.373; US 5.331.107; US 5.928.937; y US 5.378.824; y en la publicación internacional WO 1996/033270. Otras plantas tolerantes a imidazolinona se describen también, por ejemplo, en los documentos WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351, y WO 2006/060634. Las plantas tolerantes a sulfonilurea

y a imidazolinona adicionales también se describen, por ejemplo, en el documento WO 2007/024782.

Otras plantas tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea pueden obtenerse mediante mutagénesis inducida, selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o selección por mutación como se describe, por ejemplo para sojas en el documento US 5.084.082, para arroz en WO 1997/41218, para remolacha en US 5.773.702 y WO 1999/057965, para lechuga en US 5.198.599, o para girasol en WO 2001/065922.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse según la invención son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se han hecho resistentes al ataque de determinados insectos diana. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha resistencia a insectos.

Una "planta transgénica resistente a insectos", tal y como se utiliza en la presente memoria, incluye cualquier planta que contiene al menos un transgén que comprende una secuencia codificadora que codifica:

1) una proteína cristal insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una parte de ésta insecticida, tal como las proteínas cristal insecticidas listadas por Crickmore et al., *Microbiology and Molecular Biology Reviews* (1998), 62, 807-813, actualizado por Crickmore et al. (2005) en la nomenclatura de las toxinas de *Bacillus thuringiensis*, en línea en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), o partes de éstas insecticidas, por ejemplo, las proteínas de la clase Cry de proteínas Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, o Cry3Bb o partes de éstas insecticidas; o

2) una proteína cristal de *Bacillus thuringiensis* o una parte de ésta que es insecticida en presencia de una segunda proteína cristal de *Bacillus thuringiensis* o una parte de ésta, tal como la toxina binaria constituida por las proteínas cristal Cry34 y Cry35 (Moellenbeck et al., *Nat. Biotechnol.* (2001), 19, 668-72; Schnepf et al., *Applied Environm. Microbiol.* (2006), 71, 1765-1774); o

3) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas cristal insecticidas de *Bacillus thuringiensis,* tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo, la proteína Cry1A.105 producida por el maíz transgénico MON98034 (WO 2007/027777); o

4) una proteína de uno cualquiera de 1) a 3) anteriores en la que algunos aminoácidos, particularmente 1 a 10, han sido reemplazados por otro aminoácido para obtener una mayor actividad insecticida frente a especies de insecto diana, y/o para expandir la gama de especies de insectos diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificador durante la clonación o transformación, tal como la proteína Cry3Bb1 en los maíces transgénicos MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en el maíz transgénico MIR604;

5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una parte de ésta insecticida, tal como las proteínas vegetativas insecticidas (VIP) listadas en:
http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo, proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, tal como la toxina binaria constituida por las proteínas VIP1A y VIP2A (WO 1994/21795); o

7) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior; o

8) una proteína de uno cualquiera de 1) a 3) anteriores en la que algunos aminoácidos, particularmente 1 a 10, han sido reemplazados por otro aminoácido para obtener una mayor actividad insecticida frente a especies de insecto diana, y/o para expandir la gama de especies de insectos diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificador durante la clonación o transformación (aunque todavía codifica una proteína insecticida), tal como la proteína VIP3Aa en el algodón transgénico COT102.

Por supuesto, una planta transgénica resistente a insectos, tal y como se utiliza en la presente memoria, también incluye cualquier planta que comprende una combinación de los genes que codifican las proteínas de una cualquiera de las clases anteriores 1 a 8. En una realización, una planta resistente a insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de una cualquiera de las clases anteriores 1 a 8, para expandir la gama de especies de insectos diana afectadas cuando se utilizan diferentes proteínas dirigidas a diferentes especies de insectos diana, o para retardar el desarrollo de la resistencia a insectos en las plantas utilizando diferentes proteínas insecticidas para las mismas especies de insectos diana pero que tienen

un modo de acción diferente, tal como la unión a diferentes sitios de unión del receptor en el insecto.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tal como ingeniería genética) que también pueden tratarse según la invención son tolerantes a estreses abióticos. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha resistencia al estrés. Las plantas tolerantes al estrés particularmente útiles incluyen:

a. plantas que contienen un transgén capaz de reducir la expresión y/o la actividad del gen de la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células de la planta o en la planta como se describe en los documentos WO 2000/004173 o WO2006/045633 o PCT/EP07/004142.

b. plantas que contienen un transgén que incrementa la tolerancia al estrés capaz de reducir la expresión y/o la actividad de los genes que codifican PARG de las plantas o de las células de las plantas, como se describe, por ejemplo, en el documento los documentos WO 2004/090140.

c. plantas que contienen un transgén que incrementa la tolerancia al estrés que codifica una enzima funcional de la planta de la vía de síntesis del dinucléotido de nicotinamida y adenina incluyendo nicotinamidasa, nicotinato fosforribosiltransferasa, ácido nicotínico mononucleótido adenil transferasa, dinucléotido de nicotinamida y adenina sintetasa o nicotina amida fosforribosiltransferasa como se describe, por ejemplo, en los documentos WO2006/032469 o WO 2006/133827 o PCT/EP07/002433.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse según la invención muestran una cantidad, calidad y/o estabilidad en el almacenamiento alteradas del producto cosechado y/o propiedades alteradas de los ingredientes específicos del producto cosechado tales como:

1) plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado, que presenta cambios en sus características físico-químicas, en particular en el contenido en amilosa o en la

relación amilosa/amilopectina, grado de ramificación, longitud media de la cadena, distribución de la cadena lateral, comportamiento viscoso, fuerza de gelificación, tamaño del grano del almidón y/o morfología del grano del almidón, en comparación con el almidón sintetizado en células de plantas o plantas de tipo salvaje, de manera que es más adecuado para aplicaciones especiales. Dichas plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado se describen, por ejemplo, en los documentos EP 0571427, WO 1995/004826, EP 0719338, WO 1996/15248, WO 1996/19581, WO 1996/27674, WO 1997/11188, WO 1997/26362, WO 1997/32985, WO 1997/42328, WO 1997/44472, WO 1997/45545, WO 1998/27212, WO 1998/40503, WO99/58688, WO 1999/58690, WO 1999/58654, WO 2000/008184, WO 2000/008185, WO 2000/008175, WO 2000/28052, WO 2000/77229, WO 2001/12782, WO 2001/12826, WO 2002/101059, WO 2003/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 2000/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 2002/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP 07090007.1, EP 07090009.7, WO 2001/14569, WO 2002/79410, WO 2003/33540, WO 2004/078983, WO 2001/19975, WO 1995/26407, WO 1996/34968, WO 1998/20145, WO 1999/12950, WO 1999/66050, WO 1999/53072, US 6.734.341, WO 2000/11192, WO 1998/22604, WO 1998/32326, WO 2001/98509, WO 2001/98509, WO 2005/002359, US 5.824.790, US 6.013.861, WO 1994/004693, WO 1994/009144, WO 1994/11520, WO 1995/35026, WO 1997/20936.

2) plantas transgénicas que sintetizan polímeros de carbohidratos distintos del almidón o que sintetizan polímeros de carbohidratos distintos del almidón con propiedades alteradas en comparación con plantas de tipo salvaje sin modificación genética. Los ejemplos son plantas que producen polifructosa, especialmente del tipo inulina y levano, como se describe en los documentos EP 0663956, WO 1996/001904, WO 1996/021023, WO 1998/039460, y WO 1999/024593, plantas que producen alfa-1,4-glucanos como se describe en los documentos WO 1995/031553, US 2002/031826, US 6.284.479, US 5.712.107, WO 1997/047806, WO 1997/047807, WO 1997/047808 y WO 2000/014249, plantas que producen alfa-1,4-glucanos con ramificaciones alfa-1,6, como se describe en el documento WO 2000/73422, plantas que producen alternano, como se describe en los documentos WO 2000/047727, EP 06077301.7, US 5.908.975 y EP 0728213,

3) plantas transgénicas que producen hialuronano, como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006/304779, y WO 2005/012529.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse según la invención son plantas, tales como plantas de algodón, con características alteradas de la fibra. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dichas características alteradas de la fibra e incluyen:

a) Plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los genes de la celulosa sintasa como se describe en el documento WO 1998/000549
b) Plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los ácidos nucleicos homólogos de rsw2 o rsw3 como se describe en en el documento WO2004/053219
c) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen una expresión incrementada de la sacarosa fosfato sintasa como se describe en en el documento WO 2001/017333
d) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen una expresión incrementada de la sacarosa sintasa como se describe en en el documento WO02/45485
e) Plantas, tales como plantas de algodón, en las que el control temporal de la apertura de los plasmodesmata de la célula de la fibra está alterado, por ejemplo, a través de una regulación negativa de la β-1,3-glucanasa selectiva de las fibras como se describe en en el documento WO2005/017157
f) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen fibras con una reactividad alterada, por ejemplo, a través de la expresión del gen de la N-acetilglucosaminatransferasa incluyendo los genes nodC y quitinsintasa como se describe en en el documento WO2006/136351

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse según la invención son plantas, tales como colza o plantas Brassica relacionadas, con unas características alteradas del perfil del aceite. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dichas características alteradas del aceite e incluyen:

a) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un contenido alto en ácido oleico como se describe, por ejemplo, en los documentos US 5.969.169, US 5.840.946 o US 6.323.392 o US 6.063.947

b) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un contenido bajo en ácido linolénico como se describe en los documentos US 6.270828, US 6.169.190 o US 5.965.755

c) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un nivel bajo de ácidos grasos saturados como se describe, por ejemplo, en el documento US 5.434.283

Llantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que comprenden uno o más genes que codifican una o más toxinas tales como las siguientes que se venden con los nombres de mercado YIELD GARD$_3$ (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut$_3$ (por ejemplo maíz), BiteGard$_3$ (por ejemplo maíz), Bt-Xtra$_3$ (por ejemplo maíz), StarLink$_3$ (por ejemplo maíz), Bollgard$_3$ (algodón), Nucotn$_3$ (algodón), Nucotn 33B®(algodón), NatureGard$_3$ (por ejemplo maíz), Protecta$_3$ y NewLeaf$_3$ (patata). Ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas que se pueden mencionar son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden con los nombres de mercado Roundup Ready$_3$ (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link$_3$ (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI$_3$ (tolerancia a imidazolinonas) y STS$_3$ (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas producidas de una manera convencional para la tolerancia a herbicidas) que pueden mencionarse incluyen variedades vendidas con el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz).

Las plantas transgénicas particularmente útiles que pueden tratarse según la invención son plantas que contienen eventos de transformación, o combinaciones de eventos de transformación, que se listan, por ejemplo, en las bases de datos de varias agencias reguladoras nacionales o regionales (véase, por ejemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y http://www.agbios.com/dbase.php).

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

Además, los compuestos según la invención se pueden usar también para reducir el contenido de micotoxinas en plantas y el material vegetal recolectado y por lo tanto en alimentos y pienso para animales hechos con los mismos.

El método para combatir hongos que producen fitopatógenos y micotoxinas se caracterizan porque se aplican compuestos según la invención a estos hongos y/o a su hábitat.

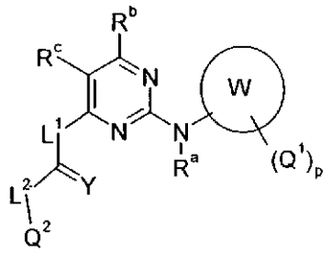
Pueden especificarse especialmente pero no exclusivamente las micotoxinas siguientes: Deoxinivalenol (DON), Nivalenol, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, Toxinas T2 y HT2, Fumonisinas, Zearalenona Moniliformina, Fusarina, Diaceotoxiscirpenol (DAS), Beauvericina, Enniatina, Fusaroproliferina, Fusarenol, Ocratoxinas, Patulina, Ergotalcaloides y Aflatoxinas, que son producidas, por ejemplo, por las enfermedades fúngicas siguientes: *Fusarium espec.*, como *Fusarium acuminatum, F. avenaceum, F. crookwellense, F. culmorum, F. graminaarum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti, F. fujikoroi, F. musarum, F. oxisporum, F. proliferatum, F. poae, F. pseudograminaarum, F. sambucinum, F. scirpi, F. semitectum, F. solani, F. sporotrichoides, F. langsethiae, F. subglutinans, F. tricinctum, F. verticillioides* y otros, y también por *Aspergillus espec., Penicillium espec., Claviceps purpurea, Stachybotrys espec.* y otros.

Lod diferentes aspectos de la invención se ilustrarán ahora con relación a las siguientes tablas I, II y III de ejemplos de compuestos y la siguiente preparación o ejemplos de eficacia.

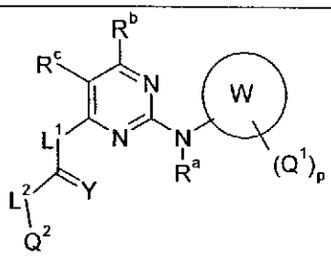
Las siguientes tablas I, II y III ilustran de manera no limitante ejemplos de compuestos de acuerdo con la invención.

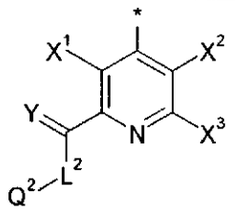
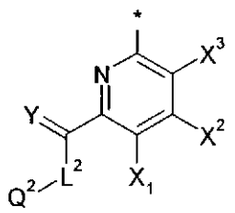
En las siguientes tablas, M+H (o M-H) significa el pico del ion molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidad de masa atómica) respectivamente, observado en espectroscopia de masas y M (Apcl+) significa el pico del ion molecular que se encontró por ionización química a presión atmosférica positiva en espectroscopia de masas.

Tabla I :

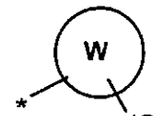


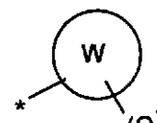
Fórmula (III_2)

 Fórmula (III_2) En la que W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes	En la Tabla I se usan las siguientes abreviaturas para *-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2:

*-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2	Abreviatura
	L1A
	L1B

Ejemplo Número	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y		X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	R^c	PM medido	log P
A1	L1A	oxi	Etilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	H	351	1,1
A2	L1A	enlace	3,6-dihidropiridin-1(2H)-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	393	2,2
A3	L1A	enlace	3,6-dihidropiridin-1(2H)-ilo	oxo	2-(3,6-dihidropiridin-1(2H)-ilcarbonil)piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	468	1,6
A4	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	2-[(2-metoxietil)(metil)carbamoilo]piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	480	1,1
A5	L1A	enlace	piperidin-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	395	2,23
A6	L1A	enlace	piperidin-1-ilo	oxo	2-(piperidin-1-ilcarbonil)piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	472	1,63
A7	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	381	2,08
A8	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	2-(pirrolidin-1-ilcarbonil)piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	444	1,37
A9	L1A	enlace	3-(hidroximetil)piperidin-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	425	1,69
A10	L1A	propilimino	2-hidroxietilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	413	1,84
A11	L1A	propilimino	Propilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	411	2,88[c]
A12	L1A	propilimino	Propilo	oxo	2-(dipropilcarbamoilo)piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	504	2,54
A13	L1A	metilimino	Propilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	383	2,2
A14	L1A	metilimino	Propilo	oxo	2-[metil(propil)carbamoilo]piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	448	1,59
A15	L1A	metilimino	tetrahidrofuran-2-ilmetilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	425	1,99

Ejemplo Número	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y		X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	R^c	PM medido	log P
A16	L1A	metilimino	tetrahidrofuran-2-ilmetilo	oxo	2-[metil(tetrahidrofuran-2-ilmetil)carbamoilo]piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	532	1,35
A17	L1A	metilimino	Etilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	369	1,91
A18	L1A	metilimino	Etilo	oxo	2-(trifluorometil)piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	403	2,22
A19	L1A	metilimino	Etilo	oxo	2-[etil(metil)carbamoilo]piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	420	1,19
A20	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-ilo)propil	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	480	2,33
A21	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-ilo)propil	oxo	2-{[3-(2-oxoazepan-1-il)propil]carbamoilo}piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	642	2,33
A22	L1A	enlace	morfolin-4-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	397	1,69
A23	L1A	enlace	morfolin-4-ilo	oxo	2-(morfolin-4-ilcarbonil)piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	476	0,92
A24	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	394	1,78
A25	L1A	metilimino	prop-2-en-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	381	2,13
A26	L1A	etilimino	Propilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	397	2,51
A27	L1A	etilimino	Etilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	383	2,17
A28	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	383	2,13
A29	L1A	metilimino	butan-2-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	397	2,47
A30	L1A	metilimino	3-metilbut-2-en-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	409	2,66
A31	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	395	2,28
A32	L1A	metilimino	Metilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	355	1,69
A33	L1B	etilimino	Etilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	383	2,6
A34	L1B	metilimino	Metilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	355	1,96[b]
A35	L1B	enlace	azetidin-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	367	2,21[b]

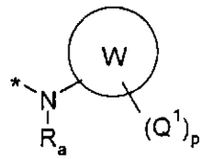
Ejemplo Número	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y		X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	R^c	PM medido	log P
A36	L1B	metilimino	Etilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	H	369	2,25[b]
A37	L1A	metilimino	Etilo	oxo	4-metiltiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	H	354	2,43
A38	L1A	etilimino	Etilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	H	354	2,55
A39	L1A	etilimino	Etilo	oxo	5-terc-butiltiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	H	410	3,62
A40	L1A	etilimino	Etilo	oxo	5-(4-fluorofenil)tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	H	448	3,71
A41	L1A	etilimino	Etilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	CH_3	368	2,61
A45	L1A	metilimino	3-metilbut-2-en-1-ilo	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	R^{a1}	H	H	481	2,49
A46	L1A	metilimino	Etilo	oxo	4,5-dimetiltiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	H	368	2,68
A47	L1A	metilimino	Etilo	oxo	5-metiltiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	H	354	2,39
A48	L1A	metilimino	CH_3	oxo	5-metiltiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	H	340	2,13

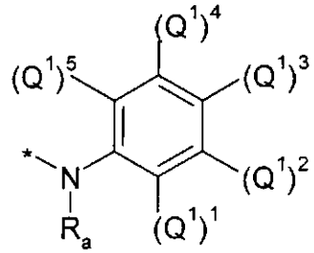
Abreviaturas: R^{a1} = metoxiacetilo;

La medición de los valores logP se realizó según la directiva de la CEE 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en columnas de fase inversa con los siguientes métodos:

Normalmente la medición de CL-EM se hizo a pH 2,7 con ácido fórmico al 0,1% en agua y con acetonitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico) como eluyente con un gradiente lineal desde 10% de acetonitrilo hasta 95% de acetonitrilo.

If $W(Q^1)_p$ = subst. Phenyl, then the position of $(Q^1)_p$ is as shown:





Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B1	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	378	2,22
B2	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	2,72
B3	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	2,72
B4	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2,82
B5	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	339	2,13
B6	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2,92
B7	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	353	2,4
B8	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	2,67
B9	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	2,26
B10	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	2,94
B11	L1A	etilimino	Etilo	tioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3,31
B12	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	tioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,42

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B13	L1A	metilimino	Propilo	tioxo	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3,32
B14	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	378	2,14
B15	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	367	2,6
B16	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	367	2,62
B17	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	379	2,73
B18	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	339	2,02
B19	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	381	2,92
B20	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	353	2,28
B21	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	367	2,55
B22	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	383	3,92
B23	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	369	2,8
B24	L1A	metilimino	1-ciclopropil-2-metoxietilo	oxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	423	2,8
B25	L1A	oxi	Metilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	342	2,79
B26	L1A	enlace	Metilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	326	3,32
B27	L1A	enlace	Metilo	metoxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	4,23
B28	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2,88
B29	L1A	enlace	Metilo	(prop-2-en-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	4,7
B30	L1A	enlace	Metilo	(but-3-in-2-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	4,47
B31	L1A	enlace	Metilo	etoxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	4,7
B32	L1A	enlace	Metilo	[2-(dimetilamino)etoxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	1,99

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^2	R^5	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B33	L1A	imino	tetrahidrofuran-2-ilmetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,09
B34	L1A	enlace	Metilo	(ciclopropilmetoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	4,94
B35	L1A	enlace	Metilo	(hex-2-in-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	421	5,16
B36	L1A	enlace	Metilo	(but-2-in-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	4,41
B37	L1A	enlace	Metilo	(prop-2-in-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	379	3,98
B38	L1A	enlace	Metilo	(ciclopentiloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	5,79
B39	L1A	enlace	Metilo	[(2,6-diclorobencil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	499	6,02
B40	L1A	enlace	Etilo	etoxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	5,1
B41	L1A	enlace	Etilo	(prop-2-en-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	5,14
B42	L1A	enlace	Etilo	(but-3-in-2-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	407	4,87
B43	L1A	enlace	Metilo	propoxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	5,13
B44	L1A	enlace	Metilo	(2-metilpropoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	5,63
B45	L1A	enlace	Etilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	340	3,79
B46	L1A	enlace	Etilo	(hex-2-in-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	435	5,81

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B47	L1A	enlace	Etilo	(ciclopentiloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	6,39
B48	L1A	enlace	Metilo	(diciclopropilmetoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	435	5,64
B49	L1A	enlace	Etilo	[2-(dimetilamino)etoxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	426	2,06
B50	L1A	enlace	Metilo	(benciloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	431	5,18
B51	L1A	imino	1-metoxipropan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3,21
B52	L1A	imino	(2S)-1-metoxipropan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3,39
B53	L1A	enlace	Etilo	(but-2-in-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	407	4,91
B54	L1A	enlace	Etilo	(ciclopropilmetoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	5,49
B55	L1A	enlace	Etilo	propoxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	5,69
B56	L1A	imino	Ciclohexilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	4,46
B57	L1A	imino	ciclopropilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	367	3,05
B58	L1A	enlace	Etilo	(2,2,2-trifluoroetoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	437	5,39
B59	L1A	imino	2-metoxietilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2,84
B60	L1A	enlace	Metilo	[(4-metoxibencil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	461	4,96

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B61	L1A	imino	3-metilbutilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4,3
B62	L1A	imino	3-metilbutan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4,3
B63	L1A	imino	pentan-3-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4,22
B64	L1A	enlace	Etilo	hidroxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	3,24
B65	L1A	enlace	Etilo	(2-metilpropoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	6,19
B66	L1A	imino	1-(dimetilamino)propan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	1,72
B67	L1A	imino	pentilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4,35
B68	L1A	enlace	Etilo	[(4-metoxibencil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	475	5,46
B69	L1A	enlace	Etilo	[(2,6-diclorobencil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	513	6,53
B70	L1A	enlace	Etilo	[(4-clorobencil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	479	6,22
B71	L1A	imino	Ciclopentilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	4,03
B72	L1A	enlace	Etilo	(benciloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	445	5,65
B73	L1A	enlace	Metilo	(2,2,2-trifluoroetoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	4,58
B74	L1A	enlace	Metilo	hidroxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	341	2,8

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B75	L1A	enlace	Metilo	2-metilhidrazininilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	354	2,27
B76	L1A	enlace	Metilo	2-(2,2,2-trifluoroetil)hidrazinilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	422	3,58
B77	L1A	enlace	Metilo	2-(2-etoxi-2-oxoetil)hidrazinilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	426	3,02
B78	L1A	enlace	amino	hidroxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	342	2,28
B79	L1A	enlace	Etilo	(diciclopropilmetoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	449	6,59
B80	L1A	enlace	Etilo	(prop-2-in-1-iloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	4,73
B81	L1A	enlace	Metilo	2-(2-cianoetil)hidrazinilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,5
B82	L1A	enlace	Metilo	2-(4-clorofenil)hidrazinilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	450	4,97
B83	L1A	enlace	Metilo	2-(metoxicarbonil)hidrazinilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	398	2,86
B84	L1A	enlace	Etilo	(1-ciclopropiletoxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	6,24
B85	L1A	enlace	Etilo	metoxiimino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	4,81

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B86	L1A	imino	1,3-dimetoxipropan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	429	3,39
B87	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-ilo)propil	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	480	3,11
B88	L1A	imino	3-metoxipropilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3,15
B89	L1A	imino	1-metoxibutan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	3,8
B90	L1A	enlace	Metilo	cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]hidrazinilideno	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	519	5,46
B91	L1A	imino	propan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	3,62
B92	L1A	imino	Etilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	3,17
B93	L1A	imino	Butilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	4,11
B94	L1A	imino	butan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	4,04
B95	L1A	imino	1-cianobutan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	408	3,35
B96	L1A	imino	4-(2-oxopirrolidin-1-il)butilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	466	2,73
B97	L1A	imino	4-etoxiciclohexilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	453	4,39
B98	L1A	imino	terc-butil	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	4,39
B99	L1A	imino	ciclopropilmetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3,73
B100	L1A	imino	3-(2-oxopirrolidin-1-il)propilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	452	2,63

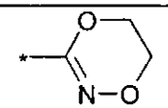
Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B101	L1A	imino	1,1-dioxidotetrahidrotiofen-3-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	445	2,66
B102	L1A	enlace	etoxi	imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	2,08
B103	L1A	imino	Propilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	3,62
B104	L1A	enlace	amino	[(metoxiacetil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	414	2,92
B105	L1A	imino	2-(morfolin-4-il)etilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	440	1,68
B106	L1A	enlace	amino	(butanoiloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	3,8
B107	L1A	enlace	amino	[(2-metilpropanoil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	412	3,69
B108	L1A	enlace	amino	(propanoiloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	398	3,33
B109	L1A	enlace	amino	(acetiloxi)imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	384	2,95
B110	L1A	enlace	amino	[(3-metilbutanoil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	426	4,12
B111	L1A	enlace	amino	[(3-metilbut-2-enoil)oxi]imino	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	424	3,92
B112	L1A	imino	oxetan-3-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	2,6
B113	L1A	imino	ciclobutilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3,89
B114	L1A	imino	1-(dietilamino)propan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	440	1,9

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^4	R^5	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B115	L1A	enlace	piperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,1
B116	L1A	enlace	morfolin-4-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	2,39
B117	L1A	imino	2,2,2-trifluoroetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,67
B118	L1A	imino	pentan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	4,54
B119	L1A	imino	H	tioxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	343	3,12
B120	L1A	enlace	4-(trifluorometil)piperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	463	3,55
B121	L1A	imino	3,3,3-trifluoropropilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,73
B122	L1A	imino	1-etilpiperidin-3-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	438	1,82
B123	L1A	metilimino	Butilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	396	3,48
B124	L1A	propilimino	Propilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	410	3,89
B125	L1A	etilimino	Propilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	396	3,46
B126	L1A	propilimino	Butilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	4,31
B127	L1A	metilimino	prop-2-en-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2,96
B128	L1A	metilimino	hexilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	4,34
B129	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	394	2,51
B130	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3,06
B131	L1A	enlace	4-metilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,51
B132	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	3,06
B133	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,15

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B134	L1A	enlace	(2R)-2-(metoximetil)pirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	3,08
B135	L1A	enlace	3-metilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,48
B136	L1A	metilimino	2-hidroxietilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2,04
B137	L1A	enlace	2,3-dimetilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,78
B138	L1A	enlace	azepan-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,46
B139	L1A	enlace	2-etilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,8
B140	L1A	enlace	3-hidroxipiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	2,2
B141	L1A	enlace	2,5-dimetilpirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,64
B142	L1A	enlace	2-metilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,39
B143	L1A	prop-2-en-1-ilimino	prop-2-en-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	407	3,67
B144	L1A	metilimino	Ciclohexilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,89
B145	L1A	enlace	3-(hidroximetil)piperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2,3
B146	L1A	metilimino	3-metilbutilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,87

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B147	L1A	enlace	3,3-dimetilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,83
B148	L1A	metilimino	3-metilbut-2-en-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,67
B149	L1A	metilimino	Ciclopentilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,51
B150	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	355	2,4
B151	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	3,42
B152	L1A	enlace	2-metilpirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,23
B153	L1A	enlace	3,6-dihidropiridin-1(2H)-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3,11
B154	L1A	enlace	2,6-dimetilmorfolin-4-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2,92
B155	L1A	enlace	3,5-dimetilpiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,96
B156	L1A	etilimino	2-metilprop-2-en-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,67
B157	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	2,69
B158	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	383	2,96
B159	L1A	propilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	423	3,94
B160	L1A	metilimino	tetrahidrofuran-2-ilmetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2,76
B161	L1A	metilimino	pentilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,89
B162	L1A	etilimino	Butilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,87

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B163	L1A	enlace	4-formilpiperazin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	424	2,04
B164	L1A	etilimino	2-hidroxietilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2,25
B165	L1A	enlace	2-(hidroximetil)piperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2,48
B166	L1A	etilimino	2-hidroxi-2-metilpropilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	427	2,66
B167	L1A	etilimino	tetrahidrofuran-2-ilmetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	439	3,09
B168	L1A	enlace	4-oxoimidazolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	396	2,15
B169	L1A	enlace	4-metoxipiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	2,68
B170	L1A	enlace	4-cianopiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	420	2,59
B171	L1A	propilimino	butan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	425	4,13
B172	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2,57
B173	L1A	enlace	4-hidroxipiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	411	2,04
B174	L1A	hexilimino	hexilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	496	6,69
B175	L1A	butilimino	Butilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	439	4,75
B176	L1A	enlace	tiomorfolin-4-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	2,98

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B177	L1A	enlace	3-hidroxipirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	397	2,07
B178	L1A	imino	3-(formilamino)propilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	394	2,26
B179	L1A	enlace	3-metoxipiperidin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	424	2,76[b]
B180	L1A	(2-hidroxietil)imino	propan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	2,45
B181	L1A	propilimino	2-hidroxietilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	413	2,51[b]
B182	L1A	propilimino	2-cianoetilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	422	3,13[b]
B183	L1A	imino	3-hidroxipropilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2,4
B184	L1A	enlace	4-metilpiperazin-1-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	410	1,5
B185	L1A	imino	hidroxi	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	343	2,13
B186	L1A	metilimino	metoxi	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	371	2,59
B187	L1A				H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	369	2,63
B188	L1A	metilimino	1-ciclopropil-2-metoxietilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	480	3,09

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^3	R^6	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B189	L1A	metilimino	3-metoxibutan-2-ilo	oxo	H	cloro	H	H	H	H	H	H	H	H	427	3,15
B190	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3
B191	L1A	imino	1-metoxipropan-2-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	417	3,48
B192	L1A	imino	ciclopropilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	385	3,31
B193	L1A	imino	2-metoxietilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	403	3,08
B194	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-ilo)propil	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	498	3,19
B195	L1A	imino	1-metoxibutan-2-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	431	3,89
B196	L1A	imino	propan-2-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	387	3,73
B197	L1A	imino	butan-2-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	4,16
B198	L1A	imino	ciclopropilmetilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3,83
B199	L1A	imino	ciclobutilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3,94
B200	L1A	imino	pentan-2-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	415	4,64
B201	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	412	2,58
B202	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	3,13
B203	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	3,13
B204	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	413	3,23
B205	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	373	2,47
B206	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	415	3,46
B207	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	387	2,75
B208	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	401	3,02
B209	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	403	3,33

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B210	L1A	metilimino	1-ciclopropil-2-metoxietilo	oxo	H	cloro	F	H	H	H	H	H	H	H	457	3,33
B211	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,82
B212	L1A	imino	1-metoxipropan-2-ilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,31
B213	L1A	imino	ciclopropilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	379	3,15
B214	L1A	imino	2-metoxietilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	397	2,92
B215	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-ilo)propil	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	492	3,02
B216	L1A	imino	1-metoxibutan-2-ilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	425	3,69
B217	L1A	imino	propan-2-ilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3,53
B218	L1A	imino	butan-2-ilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,94
B219	L1A	imino	ciclopropilmetilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3,64
B220	L1A	imino	ciclobutilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3,73
B221	L1A	imino	pentan-2-ilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	409	4,44
B222	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2,6
B223	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	397	3,17
B224	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	395	3,26
B225	L1A	imino	1-metoxipropan-2-ilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	413	3,8
B226	L1A	imino	ciclopropilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	381	3,62
B227	L1A	imino	2-metoxietilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	399	3,48
B228	L1A	imino	3-(2-oxoazepan-1-ilo)propil	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	494	3,44

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B229	L1A	imino	1-metoxibutan-2-ilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	427	4,24
B230	L1A	imino	propan-2-ilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	383	4,04
B231	L1A	imino	Etilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	369	3,55
B232	L1A	imino	butan-2-ilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	397	4,49
B233	L1A	imino	ciclopropilmetilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	395	4,16
B234	L1A	imino	ciclobutilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	395	4,29
B235	L1A	imino	pentan-2-ilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	411	5
B236	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	cloro	Me	H	H	H	H	H	H	H	383	3,02
B237	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	fluoro	H	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	396	2,1
B238	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	fluoro	H	H	fluoro	H	H	H	H	H	H	399	2,9
B239	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	404	1,94
B240	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,48
B241	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,48
B242	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	405	2,58
B243	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	365	1,91
B244	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	407	2,66
B245	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2,17
B246	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,42

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B247	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	409	2,05
B248	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	395	2,66
B249	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	tioxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	421	3,12
B250	L1A	metilimino	Propilo	tioxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	409	3,05
B251	L1A	metilimino	1-ciclopropil-2-metoxietilo	oxo	H	metoximetilo	H	H	H	H	H	H	H	H	449	2,69
B252	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	pentafluoro-lambda^{6}-sulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	461	3,06
B253	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	pentafluoro-lambda^{6}-sulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	477	3,57
B254	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	etoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2,6
B255	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	etoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,15
B256	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	trifluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	403	2,86
B257	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	trifluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	419	3,41
B258	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	propan-2-ilo	H	H	H	H	H	H	H	H	377	3,11
B259	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	propan-2-ilo	H	H	H	H	H	H	H	H	393	3,7
B260	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroetoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	451	2,92
B261	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroetoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	467	3,41
B262	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	444	2,8
B263	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3,39
B264	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3,37
B265	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	445	3,48

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B266	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	405	2,7
B267	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	447	3,73
B268	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	419	3
B269	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3,29
B270	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	449	2,86
B271	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	trifluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	435	3,57
B272	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	390	2,11
B273	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2,59
B274	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2,61
B275	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	391	2,7
B276	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	351	2,01
B277	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	393	2,90
B278	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	365	2,26
B279	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	379	2,51
B280	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	395	2,14
B281	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	381	2,78
B282	L1A	etilimino	Etilo	tioxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,15
B283	L1A	metilimino	Propilo	tioxo	H	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	395	3,15
B284	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	410	2,25
B285	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2,73
B286	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2,73
B287	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	411	2,82
B288	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	371	2,17

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B289	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	413	3,04
B290	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	difluorometilo	H	H	H	H	H	H	H	H	399	2,65
B291	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	385	1,99
B292	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	374	2,45
B293	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	374	2,45
B294	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	346	1,88
B295	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	388	2,73
B296	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	374	2,37
B297	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	426	2,37
B298	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2,88
B299	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2,86
B300	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	387	2,25
B301	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	429	3,15
B302	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2,78
B303	L1A	metilimino	1-ciclopropil-2-metoxietilo	oxo	H	difluorometoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	512	2,94
B304	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	acetilamino	H	H	H	H	H	H	H	H	417	2,08
B305	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	acetilamino	H	H	H	H	H	H	H	H	406	1,87
B306	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	acetilamino	H	H	H	H	H	H	H	H	418	1,94
B307	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	acetilamino	H	H	H	H	H	H	H	H	378	1,4
B308	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	acetilamino	H	H	H	H	H	H	H	H	420	2,1
B309	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	acetilamino	H	H	H	H	H	H	H	H	406	1,81
B310	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	360	2,07
B311	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	349	2,55

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B312	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	349	2,55
B313	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	361	2,65
B314	L1A	metilimino	Metilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	321	1,95
B315	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	363	2,84
B316	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	335	2,2
B317	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	349	2,45
B318	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	351	2,73
B319	L1A	metilimino	1-ciclopropil-2-metoxietilo	oxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	405	2,75
B320	L1A	imino	H	tioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	359	3,05
B321	L1A	imino	H	tioxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	327	2,57
B322	L1A	imino	H	tioxo	H	H	F	H	H	H	H	H	H	H	327	2,47
B323	L1A	imino	Propilo	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	353	3,17
B324	L1A	imino	H	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	311	2,09
B325	L1A	imino	prop-2-en-1-ilo	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	351	3,08
B326	L1A	etilimino	Etilo	tioxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	433	3,78
B327	L1A	etilimino	Etilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	433	3,37
B328	L1A	etilimino	Etilo	tioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	415	3,27
B329	L1A	metilimino	propan-2-ilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	433	3,29
B330	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	tioxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	411	3,76
B331	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	tioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	427	3,37
B332	L1A	metilimino	CH_3	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	405	2,73
B333	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	419	3,04
B334	L1A	metilimino	Propilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	433	3,4

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B335	L1A	metilimino	2-metilpropilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	447	3,71
B336	L1A	metilimino	Propilo	tioxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	399	3,65
B337	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	tioxo	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	377	3,23
B338	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	F	H	H	H	R_{a1}	H	H	H	H	441	2,62
B339	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	F	H	H	H	R_{a3}	H	H	H	H	411	2,73
B340	L1A	metilimino	2-cianoetilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	444	2,82
B341	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	401	2,94
B342	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	tioxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	455	3,35
B343	L1A	metilimino	2-cianoetilo	tioxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	410	3,02
B344	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	tioxo	H	H	H	H	H	R_{a3}	H	H	H	H	419	3,02
B345	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	F	H	H	H	R_{a2}	H	H	H	H	407	3,25
B346	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,23
B347	L1A	etilimino	metoxi	oxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	384	2,92
B348	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroetoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	465	3,29
B349	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	397	3,44
B350	L1A	etilimino	Etilo	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	385	2,71

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B351	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	385	2,88
B352	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	433	3,23
B353	L1A	etilimino	Etilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	417	2,86
B354	L1A	metilimino	CH_3	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	357	2,1
B355	L1A	metilimino	CH_3	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	389	2,58
B356	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,25
B357	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	429	3,33
B358	L1A	metilimino	Etilo	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	371	2,39
B359	L1A	metilimino	CH_3	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	369	2,71
B360	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,15
B361	L1A	metilimino	2-metoxietilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	433	2,75
B362	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	431	3,58
B363	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	CF_3	H	H	H	H	H	H	H	H	428	2,68
B364	L1A	metilimino	CH_3	oxo	H	1,1,2,2-tetrafluoroetoxi	H	H	H	H	H	H	H	H	437	2,64
B365	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	397	3,33
B366	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	408	2,8
B367	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	409	3,53
B368	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	411	3,78
B369	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	ciano	H	H	H	H	H	H	H	H	396	2,45
B370	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	H	H	437	2,86

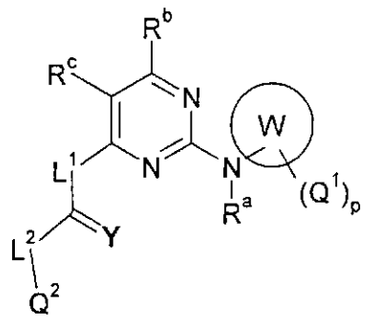
Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B371	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	421	2,75
B372	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	metilsulfanilo	H	H	H	H	H	H	H	H	417	2,96
B373	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	405	3,06
B374	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	Cl	CH_3	H	H	H	H	H	H	H	397	3,42
B375	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	F	H	H	F	H	H	H	H	H	H	397	2,82
B376	L1A	metilimino	Butilo	oxo	H	F	H	H	H	H	H	H	H	H	381	3,09
B377	L1A	metilimino	CH_3	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	357	2,25
B378	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	371	2,55
B379	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	385	2,86
B380	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	399	3,19
B381	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	397	2,98
B382	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	407	2,86
B383	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	385	2,78
B384	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	F	F	H	H	H	H	H	H	H	396	2,35
B385	L1A	metilimino	CH_3	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	405	2,59
B386	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	419	2,88
B387	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	433	3,23
B388	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	447	3,58
B389	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	444	2,69
B390	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	445	3,31
B391	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	433	3,15
B392	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	CHF_2	Cl	H	H	H	H	H	H	H	455	3,19
B393	L1A	metilimino	CH_3	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	389	2,25

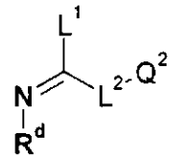
Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B394	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	403	2,55
B395	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	431	3,15
B396	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	417	2,78
B397	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	428	2,37
B398	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	439	2,84
B399	L1A	metilimino	Propilo	oxo	H	CHF_2	F	H	H	H	H	H	H	H	417	2,86
B400	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	385	2,44
B401	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	H	H	H	H	R^{a1}	H	H	H	H	433	2,37
B402	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	H	H	H	H	R^{a2}	H	H	H	H	399	2,98
B403	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	H	Cl	H	H	H	R^{a2}	H	H	H	H	432	2,77
B404	L1A	oxo	H	oxo	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	328	2,11
B405	L1A	imino	H	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	343	2.04[c]
B406	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	358	2,55

Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B407	L1A	oxo	H	oxo	H	H	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	344	1,98
B409	L1A	metilimino	Etilo	oxo	H	H	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	401	2,57
B410	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	H	H	427	2,98
B411	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	H	H	F	CHF_2	H	H	H	H	H	H	429	2,98
B412	L1A	metilimino	metoxi	oxo	H	H	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	387	2,34
B413	L1A	etilimino	metoxi	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	401	2,64
B414	L1A	etilimino	etoxi	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	415	2,88
B415	L1A	metilimino	etoxi	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	401	2,57
B416	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	metoxi	F	H	H	H	H	H	H	H	356	2,43
B417	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	metoxi	Cl	H	H	H	H	H	H	H	372	2,80
B418	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	F	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	356	2,37

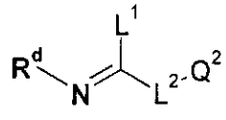
Número de ejemplo	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	$(Q1)^1$	$(Q1)^2$	$(Q1)^3$	$(Q1)^4$	$(Q1)^5$	R^a	R^b	X^1	X^2	X^3	P.M. medido	log P
B419	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	H	CH_3	Cl	H	H	H	H	H	H	356	3,17
B420	L1A	etilimino	prop-2-in-1-ilo	oxo	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	H	H	409	2,86
B421	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	metoxi	bromo	H	H	H	H	H	H	H	416	2,90
B422	L1A	oxo	CH_3	oxo	H	metoxi	metoxi	H	H	H	H	H	H	H	368	2.02[c]
B423	L1A	metilimino	CH_3	tioxo	H	H	H	CHF_2	H	H	H	H	H	H	387	2,66
B424	L1A	metilimino	Etilo	tioxo	H	CHF_2O	H	H	H	H	H	H	H	H	417	3,06

Abreviaturas: R^{a1} = metoxiacetilo; R^{a2} = prop-2-in-1-ilo; R^{a3} = acetilo

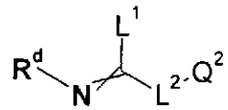




E



Z



double bond either:
E,Z mixture
or double bond geometry not specified

La geometría del doble enlace C=Y de los siguientes compuestos de la tabla II es un doble enlace de (una mezcla de isómeros E,Z o doble enlace de geometría no especificada):

B29, B30, B31, B32, B34, B35, B36, B37, B38, B39, B40, B41, B42, B43, B44, B46, B47, B48, B49, B50, B53, B54, B55, B58, B60, B64, B65, B68, B69, B70, B72, B73, B74, B79, B80, B84, B85.

La geometría del doble enlace de C=Y de los siguientes compuestos de la tabla II es E:

B104, B106, B107, B108, B109, B110, B111, B27, B75, B76, B77, B78, B81, B82, B83, B90.

Por supuesto, se reivindican todas las formas estereoisómeras en esta invención (doble enlace = E, Z, mezcla E,Z).

La medición de los valores logP se realizó según la directiva de la CEE 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en columnas de fase inversa con los siguientes métodos:

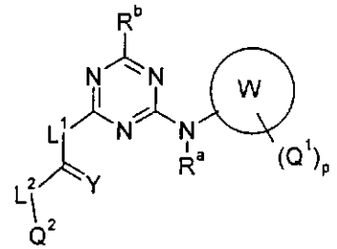
Normalmente la medición de CL-EM se hizo a pH 2,7 con ácido fórmico al 0,1% en agua y con acetonitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico) como eluyente con un gradiente lineal desde 10% de acetonitrilo hasta 95% de acetonitrilo.

[b] La medición se hizo a pH 2,3 con ácido fosfórico al 0,1% y acetonitrilo como eluyente.

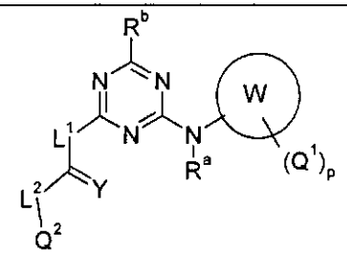
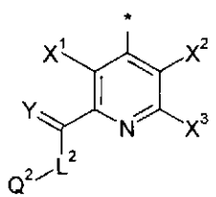
[c] La medición de CL-EM se hizo a pH 7,8 con disolución de hidrogenocarbonato de amonio 0,001 molar en agua como eluyente con un gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo.

La calibración se hizo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (medición de valores de logP usando tiempos de retención con interpolación lineal entre alcanonas sucesivas). Los valores máximos de lambda se determinaron usando espectros UV de 200 nm a 400 nm y los valores pico de las señales cromatográficas.

Tabla III:



Fórmula (III_1)

Fórmula (IV)	En la **tabla III** se usan las mismas abreviaturas para ***-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2** que se han usado en la tabla I.	
	***-L^1-C(=Y)-L^2-Q^2**	**Abreviatura**
 Fórmula (III_1) En la que W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes		L1A

Ejemplo Número	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	HET-(Q1)p	X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	P.M. medido	log P
C1	L1A	enlace	pirrolidin-1-ilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	378	1,99[c]
C2	L1A	enlace	piperidin-1-ilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	392	2,14[c]
C3	L1A	propilimino	Propilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	408	2,77[c]
C4	L1A	etilimino	Etilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	380	2,11[c]
C5	L1A	metilimino	Propilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	380	2,11[c]
C6	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	392	2,2
C7	L1A	prop-2-en-1-ilimino	prop-2-en-1-ilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	404	2,58[c]
C8	L1A	metilimino	Metilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	352	1,57
C9	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	394	2,37
C10	L1A	metilimino	Etilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	366	1,82
C11	L1A	etilimino	Butilo	oxo	6-metoxipiridin-3-ilo	H	H	H	H	H	408	2,78
C12	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	366	1,89
C13	L1A	etilimino	Etilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	355	2,44
C14	L1A	metilimino	Propilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	355	2,45
C15	L1A	metilimino	ciclopropilmetilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	367	2,53
C16	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	369	2,63
C17	L1A	metilimino	Etilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	341	2,13
C18	L1A	metilimino	2-metilpropilo	oxo	piridin-4-ilo	H	H	H	H	H	364	1,19
C19	L1A	metilimino	CH_3	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	327	1,86
C20	L1A	metilimino	propan-2-ilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	355	2,37
C21	L1A	metilimino	2,2-difluoroetilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	377	2,46
C22	L1A	etilimino	Etilo	S	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	371	3,02

Ejemplo Número	$L^1C(=Y)L^2Q^2$	L^2	Q^2	Y	HET-(Q1)p	X^1	X^2	X^3	R^a	R^b	P.M. medido	log P
C23	L1A	metilimino	Etilo	S	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	357	2,68
C24	L1A	O	CH_3	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	314	2,23
C25	L1A	O	CH_3	oxo	2-cloropiridin-4-ilo	H	H	H	H	H	343	2,02
C28	L1A	O	H	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	300	1,62
C29	L1A	metilimino	2-cianoetilo	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	CH_3-CO	H	408	1,78
C30	L1A	metilimino	metoxi	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	343	2,05
C31	L1A	etilimino	etoxi	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	371	2,59
C32	L1A	etilimino	metoxi	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	357	2,33[c]
C33	L1A	metilimino	etoxi	oxo	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	H	357	2,26

La medición de los valores logP se realizó según la directiva de la CEE 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en columnas de fase inversa con los siguientes métodos:

Normalmente la medición de CL-EM se hizo a pH 2,7 con ácido fórmico al 0,1% en agua y con acetonitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico) como eluyente con un gradiente lineal desde 10% de acetonitrilo hasta 95% de acetonitrilo.

[b] La medición se hizo a pH 2,3 con ácido fosfórico al 0,1% y acetonitrilo como eluyente.

Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitante la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (II) a (IV) según la invención.

Preparación de 4-{2-[(6-metoxipiridin-3-il)amino]pirimidin-4-il}piridina-2-carboxilato de etilo (Compuesto A-1)

Se agitaron 150 mg de 3-[3-(dimetilamino)prop-2-enoil]piridina-2-carboxilato de etilo (0,6 mmol), 138 mg de nitrato de 1-(6-metoxipiridin-3-il)guanidina (0,6 mmol) y 64 mg de carbonato de sodio (0,6 mmol) durante 8 hora a reflujo en 3,38 ml de 2-metoxietanol. Después de enfriar, se añadió agua y el precipitado se filtró y se secó para dar 65 mg de 4-{2-[(6-metoxipiridin-3-il)amino]-pirimidin-4-il}piridina-2-carboxilato de etilo (rendimiento = 53%) [M + 1] = 352.

Preparación de 4-{2-[(2-cloropiridin-4-il)amino]pirimidin-4-il}-N-etil-N-metilpiridina-2-carboxamida (Compuesto A-17) y N-etil-4-[2-({2-[etil(metil)carbamoilo]piridin-4-il}amino)pirimidin-4-il]-N-metilpiridina-2-carboxamida (Compuesto A-19) de acuerdo con el procedimiento P1A

Etapa 1: Preparación de {(Z)-[(2-cloropiridin-4-il)amino]metililiden}biscarbamato de di-terc-butilo:

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

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

A una disolución de 43,67 g (0,117 mol) de {(Z)-[(2-cloropiridin-4-il)amino]metililiden}biscarbamato di-de terc-butilo en diclorometano (800 ml) a temperatura ambiente se añadieron 81,64 ml de ácido trifluoroacético (1,06 mol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 días, se concentró a vacío, se trituró con 100 ml de pentano, y tras reposar cristalizó para dar 51,68 g de bis(trifluoroacetato) de 1-(2-cloropiridin-4-il)guanidina (rendimiento = 99%). [M + 1-2*CF_3CO_2H] = 171

Etapa 3: Preparación de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina de acuerdo con el procedimiento A-1:

A una disolución de 6,32 g de 1-(2-cloropiridin-4-il)-3-(dimetilamino)prop-2-en-1-ona (30 mmol) en 60 ml de 2-propanol se añadieron 2,52 g de hidróxido de sodio (63 mmol) y 11,96 g de bis(trifluoroacetato) de 1-(2-cloropiridin-4-il)guanidina (30 mmol). La mezcla de reacción se calentó a reflujo con agitación durante 20 h. Después de filtrar, el precipitado se lavó con 100 ml de *n*-butanol y 120 ml de i-Pr_2O y después se secó al aire para dar 4,69 g de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina (rendimiento = 37%). [M + 1] = 318

Etapa 4 : Preparación de 4-{2-[(2-cloropiridin-4-il)amino]pirimidin-4-il}-N-etil-N-metilpiridina-2-carboxamida (Compuesto A-17) y N-etil-4-[2-({2-[etil(metil)carbamoilo]piridin-4-il}amino)pirimidin-4-il]-N-metilpiridina-2-carboxamida (Compuesto A-19)

Se diluyeron 200 mg de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina (0,63 mmol), 111 mg de N-Metil-N-etilamina (1,89 mmol), 166 mg de hexacarbonilmolibdeno (0,631 mmol), 0,282 ml de 1,8-diazabiciclo(5.4.0)undec-7-eno (1,89 mmol) y 72,9 mg (0,063 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) en 5 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agitó durante 5 horas a 100°C. Después de enfriar, se añadieron 10 ml de una disolución saturada de NH4Cl y la mezcla se extrajo con 5 ml de diclorometano. Tras evaporación del disolvente, el producto bruto se cromatografió en sílice (diclorometano / etanol) para dar 58 mg de 4-{2-[(2-cloropiridin-4-il)amino]pirimidin-4-il}-N-etil-N-metilpiridina-2-carboxamida (rendimiento = 22 %) [M + 1] = 479 y 130 mg de N-etil-4-[2-({2-[etil(metil)carbamoilo]piridin-4-il}amino)pirimidin-4-il]-N-metilpiridina-2-carboxamida (rendimiento = 44 %) [M + 1] = 420.

Preparación de 4-{2-[(5-terc-butil-2-tienil)amino]pirimidin-4-il}-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (Compuesto A-39) de acuerdo con el procedimiento P12

Etapa 1: Preparación de N,N-dietil-4-yodopiridina-2-carboxamida

A una disolución de 24,5 g (93,4 mmol) de ácido 4-yodopiridina-2-carboxílico en 600 ml de diclorometano se añadieron en atmósfera de argón 34 ml (197 mmol) de N,N-diisopropiletilamina. Después de enfriar a 0°C, se añadieron gota a gota 12,7 ml (103 mmol) de cloruro de 2,2-dimetilpropionilo y se agitó durante 1 h a ° C, seguido de la adición gota a gota de 20,3 ml (197 mmol) de dietilamina. La agitación se continuó durante 1 hora a 0°C y 1 hora a temperatura ambiente. Después se añadieron 300 ml de agua y la fase acuosa se extrajo dos veces adicionales con 100 ml de diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se secaron y el disolvente se separó a vacío. El producto bruto se purificó por cromatografía en sílice

(heptano / acetato de etilo) para dar 23,4 g N,N-dietil-4-yodopiridina-2-carboxamida (rendimiento = 72%) [M + 1] = 305.

Etapa 2: Preparación de N,N-dietil-4-(tributilestanil)piridina-2-carboxamida

Se disolvieron 5 g (16,44 mmol) de N,N-dietil-4-yodopiridina-2-carboxamida (obtenida en la etapa 1) en atmósfera de argón en 40 ml de 1,4-dioxano seguido de la adición de 19,075 g (32,88 mmol) de hexabutildiestaño y 0,577 g (0,822 mmol) de diclorobis(trifenilfosfina)paladio(II). La mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas. Después de enfriar, la suspensión se pasó por un cartucho de sílice de 10 g, el cartucho se aclaró con 10 ml de 1,4-dioxano y el disolvente se separó a vacío. El producto bruto se purificó por cromatografía en sílice (heptano / acetato de etilo) para dar 4,27 g de N,N-dietil-4-(tributilestanil)piridina-2-carboxamida (rendimiento = 55%) [M + 1] = 468.

Etapa 3: Preparación de 4-(2-cloropirimidin-4-il)-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida

Una disolución de 2,5 g (5,35 mmol) de N,N-dietil-4-(tributilestanil)piridina-2-carboxamida (obtenida de la etapa 2) en 18 ml de 1,4-dioxano se puso en un tubo de microondas de 20 ml seguido de la adición de 1,03 g (7 mmol) de 2,4-dicloropirimidina y 0,62 g (0,535 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0). La mezcla se trató en el microondas en un aparato Biotage Optimizer a 150°C durante 20 minutos. Después de enfriar, se añadieron 20 ml de diclorometano, la suspensión resultante se filtró y el filtrado se concentró a vacío. Al residuo obtenido se añadieron 50 ml de disolución saturada de fluoruro de potasio y se agitó durante 15 min, seguido de la extracción con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron, se evaporaron y el producto bruto se purificó por cromatografía en sílice (heptano / acetato de etilo) seguido de cromatografía en sílice (diclorometano / acetona) para dar 400 mg de 4-(2-cloropirimidin-4-il)-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (rendimiento = 25%). [M + 1] = 291.

Etapa 4 : Preparación de (5-terc-butil-2-tienil)carbamato de terc-butilo

En una atmósfera de argón, se disolvió 1 g (5,4 mmol) de ácido 5-terc-butiltiofeno-2-carboxílico en 10 ml de terc-butanol. Después de añadir 1,54 g (5,4 mmol) de fosforoazidato de difenilo y 0,76 ml (5,4 mmol) de trietilamina, la mezcla resultante se calentó a reflujo durante 6 horas, seguido de agitación a 50°C durante 16 horas. Después de enfriar, se añadieron 50 ml de agua y la mezcla se extrajo 3 veces con 10 ml de acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron y después de evaporar el disolvente el producto bruto se purificó por cromatografía en sílice (heptano / acetato de etilo) para dar 415 mg de (5-terc-butil-2-tienil)carbamato de terc-butilo (rendimiento = 30%).

Etapa 5: Preparación de 4-{2-[(5-terc-butil-2-tienil)amino]pirimidin-4-il}-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (Compuesto A-39)

A una disolución de 105 mg (0,41 mmol) de (5-terc-butil-2-tienil)carbamato de terc-butilo (obtenida de la etapa 4) en 3 ml de 1,4-dioxano se añadieron 100 mg (0,34 mmol) de 4-(2-cloropirimidin-4-il)-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (obtenida en la etapa 3) y 98 mg (0,51 mmol) de ácido 4-toluenosulfónico monohidrato y se calentó a reflujo durante 20 horas. Después de enfriar, se añadieron 3 ml de agua y la mezcla se extrajo 3 veces con 3 ml de diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se secaron y después de evaporar el disolvente, el producto bruto se purificó por cromatografía en sílice para dar 60 mg de 4-{2-[(5-terc-butil-2-tienil)amino]pirimidin-4-il}-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (rendimiento = 41%) [M + 1] = 410.

Preparación de N,N-dietil-4-[5-metil-2-(3-tienilamino)pirimidin-4-il]piridina-2-carboxamida (Compuesto A-41) de acuerdo con el procedimiento P12

Etapa 1: Preparación de 4-(2-cloro-5-metilpirimidin-4-il)-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida

Una disolución de 1 g (2,05 mmol) de N,N-dietil-4-(tributilestanil)piridina-2-carboxamida (obtenida de la etapa 2 Compuesto A-39) en 8 ml de 1,4-dioxano se puso en un tubo de microondas de 10 ml seguido de la adición de 435 mg (2,67 mmol) de 2,4-dicloro-5-metilpirimidina y 0,23 g (0,2 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0). La mezcla se trató en el microondas en un aparato Biotage Optimizer a 150°C durante 20 minutos. Después de enfriar, se añadieron 10 ml de diclorometano, la suspensión resultante se filtró y el filtrado se concentró a vacío. Al residuo obtenido se añadieron 20 ml de disolución saturada de fluoruro de potasio y se agitó durante 15 min, seguido de la extracción con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron, se evaporaron y el producto bruto se purificó por cromatografía en sílice (heptano / acetato de etilo) para dar 400 mg de 4-(2-cloro-5-metilpirimidin-4-il)-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (rendimiento = 30%) [M + 1] = 306.

Etapa 2: Preparación de N,N-dietil-4-[5-metil-2-(3-tienilamino)pirimidin-4-il]piridina-2-carboxamida (Compuesto A-41)

A una disolución de 60 mg (0,2 mmol) de 4-(2-cloro-5-metilpirimidin-4-il)-N,N-dietilpiridina-2-carboxamida (obtenida de la etapa 1) en 3 ml de 1,4-dioxano se añadieron 144 mg (0,76 mmol) de la sal de ácido oxálico y tiofen-3-ilamina y 21 mg (0,11 mmol) de ácido 4-toluenosulfónico monohidrato y se calentó a reflujo durante 10 días. Después de enfriar, se añadieron 3 ml de agua y la mezcla se extrajo 3 veces con 3 ml de diclorometano. Las capas orgánicas

combinadas se lavaron sucesivamente con 2 ml de NaOH 1 M, 2 ml de HCl 1 M y salmuera. Después de evaporar el disolvente, el producto bruto se purificó por HPLC prep. para dar 3 mg de N,N-dietil-4-[5-metil-2-(3-tienilamino)pirimidin-4-il]piridina-2-carboxamida (rendimiento = 4%) [M + 1] = 368.

Preparación de 1-(4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)etanona (Compuesto B-26) de acuerdo con el procedimiento P1

Etapa 1:

Preparación de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carbonitrilo

A una disolución de 70 g de N-(3-clorofenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina (preparada como se describe en el documento WO 2005/033095) en 350 ml de N,N-dimetilformamida se añadieron en atmósfera de argón 38,75 g (330 mmol) de cianuro de cinc y 50,85 g (44 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0). La mezcla se calentó durante 3 horas a 100°C. Después de enfriar, la suspensión resultante se filtró, el precipitado se lavó con N,N-dimetilformamida y los filtrados combinados se evaporaron. El sólido que quedaba se recristalizó en diclorometano dando 54,39 g de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carbonitrilo (rendimiento = 80%) [M + 1] = 310.

Etapa 2:

A 130 ml de tetrahidrofurano se añadieron 26 ml de una disolución de bromuro de metilmagnesio 3 M en tolueno y se enfrió a 0°C. Después, se añadieron 8 g (26 mmol) de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carbonitrilo en pequeñas porciones y se continuó agitando durante 3 horas a 0°C. Después de calentar a temperatura ambiente, la agitación se continuó durante 4 horas. Después, se añadieron 120 ml de HCl 1 N y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron y evaporaron para dar 8,13 g de 1-(4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)etanona (rendimiento = 96%) [M + 1] = 327.

Preparación de N-(3-clorofenil)-4-{2-[(1*E*)-N-metoxietanimidoil]piridin-4-il}-1,3,5-triazin-2-amina (Compuesto B-27) de acuerdo con el procedimiento P2

Se agitaron 50 mg (0,15 mmol) de 1-(4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)etanona, 26 mg (0,3 mmol) de hidrocloruro de O-metilhidroxilamina y 26 mg (0,31 mmol) de acetato de sodio disueltos en 3 ml de etanol a reflujo durante 6 horas. Después de enfriar, el disolvente se evaporó a vacío y se añadieron 5 ml de agua. El sólido se filtró, se lavó con agua y se secó para dar 21 mg de N-(3-clorofenil)-4-{2-[(1*E*)-N-metoxietanimidoil]piridin-

4-il}-1,3,5-triazin-2-amina (rendimiento = 35%) [M + 1] = 356.

Preparación de 3-{2-[1-(4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)etiliden]hidrazinil}propanonitrilo (Compuesto B-81) de acuerdo con el procedimiento P2

A una disolución de 200 mg (0,62 mmol) de 1-(4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)etanona, 0,028 ml (0,49 mmol) de ácido acético y 51 mg (0,62 mmol) de acetato de sodio en 2 ml de metanol se añadieron 52 mg (0,62 mmol) de 3-hidrazinilpropanonitrilo disueltos en 2 ml de metanol y se agitó a reflujo durante 2 horas y a temperatura ambiente durante una noche. El disolvente se evaporó a vacío y se añadieron 30 ml de agua. La mezcla se extrajo con diclorometano, las fases orgánicas combinadas se secaron y evaporaron para dar 1280 mg de 3-{2-[1-(4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)etiliden]hidrazinil}propanonitrilo (rendimiento = 53%) [M + 1] = 394.

Preparación de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N'-hidroxipiridina-2-carboximidamida (Compuesto B-78) de acuerdo con el procedimiento P1

Una disolución de 1,5 g (4,86 mmol) de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carbonitrilo, 675 mg (9,7 mmol) de hidrocloruro de hidroxilamina y 1,34 g (9,7 mmol) de carbonato de potasio disueltos en 20 ml de etanol, se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas. Después de evaporar el disolvente, se añadió agua y el sólido que quedaba se filtró y se secó para dar 1,566 g de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N'-hidroxipiridina-2-carboximidamida (rendimiento = 94%) [M + 1] = 343.

Preparación de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N'-[(metoxiacetil)oxi]piridina-2-carboximidamida (Compuesto B-104)

Una disolución de 200 mg (0,58 mmol) de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N'-hidroxipiridina-2-carboximidamida, 63 mg (0,58 mmol) de cloruro de metoxiacetilo y 49 mg (0,58 mmol) de bicarbonato de sodio disueltos en 5 ml de acetona, se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Después de evaporar el disolvente, se añadieron 30 ml de agua y el sólido que quedaba se filtró y se secó para dar 145 mg de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N'-[(metoxiacetil)oxi]piridina-2-carboximidamida (rendimiento = 60%) [M + 1] = 415.

Preparación de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboximidoato de etilo (Compuesto B-102) de acuerdo con el procedimiento P1

Una disolución de 200 mg (0,65 mmol) de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carbonitrilo, 126 mg (1,3 mmol) de hidrocloruro de O-etilhidroxilamina y 179 mg (1,3 mmol) de

carbonato de potasio disueltos en 20 ml de etanol, se agitó a 70°C durante 5 horas. Después de enfriar y evaporar el disolvente, se añadió agua y el sólido que quedaba se filtró y se secó para dar 178 mg de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboximidoato (rendimiento = 74%) [M + 1] = 356.

Preparación de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N-hidroxipiridina-2-carboxamida (Compuesto B-185) de acuerdo con el procedimiento P9

Etapa 1: Preparación de ácido 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboxílico

A una disolución de 3 g (9,7 mmol) de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carbonitrilo en 60 ml de etanol, se añadieron 1,166 g (29,1 mmol) de hidróxido sódico disuelto en 35 ml de agua. La mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de enfriar, se añadió agua y la mezcla se acidificó con HCl 1 N. El precipitado que se formó, se filtró, se lavó con agua y se secó para dar 2,6 g de ácido 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboxílico (rendimiento = 81%) [M + 1] = 329

Etapa 2: Preparación de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N-hidroxipiridina-2-carboxamida

A una disolución de 500 mg (1,53 mmol) de ácido 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboxílico disuelto en 6 ml de dimetilformamida, se añadieron 463 mg (4,58 mmol) de trietilamina, 212 mg (3,05 mmol) de hidrocloruro de hidroxilamina y 696 mg (1,83 mmol) de hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Después de añadir agua, la mezcla se extrajo con diclorometano y la capa orgánica se lavó sucesivamente con HCl 1 N, disolución saturada de bicarbonato de sodio y disolución saturada de cloruro de litio. Después de evaporar el disolvente, el residuo se agitó con metanol, se filtró y se secó para dar 165 mg de 4-{4-[(3-clorofenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-N-hidroxipiridina-2-carboxamida (rendimiento = 29%) [M + 1] = 344.

Preparación de N-etil-N-metil-4-(4-{[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanil)fenil]amino}-1,3,5-triazin-2-il)piridina-2-carbotioamida (Compuesto B-253) de acuerdo con el procedimiento P10

A 130 mg (0,28 mmol) de N-etil-N-metil-4-(4-{[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanil)fenil]amino}-1,3,5-triazin-2-il)piridina-2-carboxamida disuelta en 5 ml de tolueno, se añadieron 31,4 mg (0,14 mmol) de pentasulfuro de fósforo. La mezcla de reacción se agitó a reflujo durante 2 horas, después se añadieron 2 ml de agua y la mezcla de reacción se agitó a 100°C durante 1 hora. Después de enfriar, se separó el agua por filtración en un cartucho de extracción de fase sólida.

Después de aclarar el cartucho con 3 ml de tolueno, el filtrado se purificó por cromatografía en sílice (diclorometano / etanol) para dar 55 mg de N-etil-N-metil-4-(4-{[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanil)fenil]amino}-1,3,5-triazin-2-il)piridina-2-carbotioamida (rendimiento = 41%) [M + 1] = 477.

Preparación de N-(4-{2-[(ciclopropilmetil)(metil)carbamotioil]piridin-4-il}-1,3,5-triazin-2-il)-N-fenilacetamida (Compuesto B-344)

Se añadieron 118 mg (0,71 mmol) de hexametildisilazano de litio a 263 mg (0,64 mmol) de 4-(4-anilino-1,3,5-triazin-2-il)-N-(ciclopropilmetil)-N-metilpiridina-2-carbotioamida (preparada de forma análoga al compuesto B-253) disuelta en 5 ml de tetrahidrofurano anhidro. Después de agitar durante 30 minutos se añadieron 55 mg (0,71 mmol) de cloruro de acetilo y se continuó la agitación durante 20 horas. Después, se añadieron 5 ml de agua y la fase orgánica se filtró a través de un cartucho Chemelute. Se usó diclorometano seguido de acetato de etilo para aclarar el cartucho y las fases orgánicas concentradas se purificaron en una columna de gel de sílice (acetato de etilo / diclorometano) seguido de RP-HPLC prep. para dar 110 mg de N-(4-{2-[(ciclopropilmetil)(metil)carbamotioil]piridin-4-il}-1,3,5-triazin-2-il)-N-fenilacetamida (rendimiento = 39%) [M + 1] = 419.

Preparación de N-(ciclopropilmetil)-N-metil-4-{4-[fenil(prop-2-in-1-il)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboxamida (Compuesto B-402)

Se añadieron 371 mg (2,22 mmol) de hexametildisilazano de litio a 400 mg (1,11 mmol) de 4-(4-anilino-1,3,5-triazin-2-il)-N-(ciclopropilmetil)-N-metilpiridina-2-carboxamida (preparada de forma análoga al compuesto C-2) disuelta en 5 ml de tetrahidrofurano anhidro. Después de agitar durante 30 minutos se añadieron 330 mg (2,22 mmol) 3-bromoprop-1-ino y se continuó la agitación durante 20 horas. Después, se añadieron 4 ml de agua y la fase orgánica se filtró a través de un cartucho Chemelute. Se usa diclorometano para aclarar el cartucho y las fases orgánicas concentradas se purifican en una columna de gel de sílice (acetato de etilo / diclorometano) para dar 180 mg de N-(ciclopropilmetil)-N-metil-4-{4-[fenil(prop-2-in-1-il)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridina-2-carboxamida (rendimiento = 26%) [M + 1] = 399.

Preparación de (4-{4-[(6-metoxipiridin-3-il)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)(piperidin-1-il)metanona (Compuesto C-2) de acuerdo con el procedimiento P1

Etapa 1: Preparación de 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-metoxipiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina:

A una disolución de 3,406 g (15 mmol) de 2-cloro-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazina (preparada como se describe en el documento WO 2001/25220) y de 1,862 g (15 mmol) de 6-metoxipiridin-3-amina en 250 ml de acetonitrilo se añadieron 2,073 g (15 mmol) de carbonato de potasio. La

mezcla de reacción se agitó durante 3 días. Después de evaporar el disolvente, el residuo se trató con agua, se filtró y se secó para dar 4,0 g de 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-metoxipiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina (rendimiento = 84%) [M + 1] = 316.

Etapa 2: Preparación de (4-{4-[(6-metoxipiridin-3-il)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)(piperidin-1-il)-metanona (Compuesto C-2)

Se diluyeron 300 mg de 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-metoxipiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina (0,95 mmol), 243 mg de piperidina (2,86 mmol), 252 mg de hexacarbonilmolibdeno (0,95 mmol), 0,427 ml de 1,8-diazabiciclo(5.4.0)undec-7-eno (2,86 mmol) y 110 mg (0,095 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) en 8 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agitó durante 5 horas a 80°C. Después de enfriar, se añadieron 10 ml de una disolución saturada de cloruro amónico y la mezcla se extrajo con 5 ml de diclorometano. Después de evaporar el disolvente, el producto bruto se cromatografió en sílice (diclorometano / etanol) para dar 99 mg de (4-{4-[(6-metoxipiridin-3-il)amino]-1,3,5-triazin-2-il}piridin-2-il)(piperidin-1-il)-metanona (rendimiento = 26%) [M + 1] = 393.

Preparación de N-metoxi-N-metil-4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxamida (Compuesto C-30) de acuerdo con el procedimiento P9

Etapa 1: Preparación de 4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxilato de metilo (Compuesto C-24) de acuerdo con el procedimiento P12

A una disolución de 5 g (20 mmol) de 4-(4-cloro-1,3,5-triazin-2-il)piridina-2-carboxilato de metilo (preparado como se describe en el documento WO 2007/003525) y de 7,55 g (40 mmol) de sal de ácido oxálico y tiofen-3-ilamina en 150 ml de acetonitrilo, se añadieron 5,5 g (40 mmol) de carbonato de potasio. La mezcla de reacción se agitó durante 7 horas a temperatura ambiente. La suspensión resultante se filtró, el precipitado se lavó con agua seguido de acetonitrilo y finalmente diisopropiléter para dar 3,7 g de 4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxilato de metilo (rendimiento = 58%) [M + 1] = 314.

Etapa 2: Preparación de ácido 4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxílico (Compuesto C-28)

Se suspendieron 2 g (6,38 mmol) de 4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxilato de metilo (obtenida de la etapa 1) en 20 ml de tetrahidrofurano seguido de la adición de 19 ml de hidróxido de litio 1 M. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos y después se evaporó el tetrahidrofurano. La disolución acuosa resultante se mantuvo durante la noche mientras se formaba un precipitado que se separó por filtración. El filtrado se acidificó a

pH 2 con HCl 2 N. El precipitado formado se filtró y se secó para dar 1,9 g de ácido 4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxílico (rendimiento = 97%) [M + 1] = 300.

Etapa 3: Preparación de N-metoxi-N-metil-4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxamida (Compuesto C-30)

A una disolución de 200 mg (0,67 mmol) de ácido 4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxílico (obtenido de la etapa 2) disuelto en 7 ml de dimetilformamida se añadieron 203 mg (2 mmol) de trietilamina, 130 mg (1,34 mmol) de hidrocloruro de N,O-dimetilhidroxilamina y 305 mg (0,8 mmol) de hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 22 horas. Después de añadir agua, la mezcla se extrajo con diclorometano y la capa orgánica se lavó sucesivamente con HCl 1 N, disolución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. Después de secado, el disolvente se evaporó para dar 195 mg de N-metoxi-N-metil-4-[4-(3-tienilamino)-1,3,5-triazin-2-il]piridina-2-carboxamida (rendimiento = 81%) [M + 1] = 343.

Ejemplos Biológicos

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

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

Las plantas de repollo (variedad Eminence), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se tratan en 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 rerepollo 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 protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: A5, A11, B2, B6, B20, B27, B64, B76, B111, B116,

B119, B123, B127, B129, B130, B132, B133, B134, B135, B139, B150, B151, B152, B156, B157, B158, B162, B163, B164, B165, B169, B170, B172, B173, B179, B180, B181, B186, B222, B236, B238, B239, B244, B254, B256, B258, B260, B268, B316, C2, C16.

Ejemplo B : ensayo in vivo en *Botrytis cinerea* (moho gris)

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

Las plantas de pepinillo (variedad Petit vert de Paris) en semilleros, sembradas en un substrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se trataron en el estadio de cotiledón Z11 pulverizando con el ingrediente activo preparado como se ha descrito 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 protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: A13, A15, A25, A26, A27, A29, A30, A31, A32, B1, B2, B6, B7, B20, B64, B115, B123, B124, B125, B127, B130, B131, B132, B133, B134, B135, B141, B143, B144, B146, B147, B148, B149, B150, B151, B152, B153, B155, B156, B157, B160, B161, B162, B163, B165, B169, B179, B186, B222, B236, B237, B238, B244, B254, B260, B268, B316, C5, C9, C11, C12, C16.

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

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

Plantas de rábano (variedad Pernot), en semilleros, sembradas en un substrato 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 a 7 días a aproximadamente 18°C, en una atmósfera húmeda.
La clasificación se llevó a cabo 6 a 7 días después de la contaminación, comparando con las plantas de referencia.
En estas condiciones, se observa una protección buena (de al menos 70%) con una dosis de 500 ppm con los compuestos siguientes: B54, B55, B64, B91, B93, B94, B97, B115, B123, B124, B125, B127, B130, B131, B132, B133, B134, B135, B137, B138, B141, B142, B143, B144, B146, B148, B151, B152, B153, B156, B158, B159, B160, B161, B162, B165, B166, B167, B169, B171, B183, B184, B186.

Ejemplo D : Prueba *in vivo en Sphaerotheca fuliginea* (oídio en cucurbitáceas)

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

Plantas de pepinillo (variedad vert petit de París) en semilleros, sembradas en un substrato 50/50 de turba-puzolana y cultivadas a 20°C/23°C, se tratan en el estadio de cotiledón Z10 pulverizando con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.
Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000 esporas por ml). Se recogen esporas de una

planta contaminada. Se incuban plantas de pepinillo contaminadas entre aproximadamente 20°C y 25°C y a humedad relativa del 60 al 70%.

La clasificación (% de eficacia) se llevó a cabo 12 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: A5, A18, A24, A26, A27, A29, A30, A32, B2, B6, B7, B20, B123, B127, B222, B225, B236, B239, B244, B254, B256, B258, B260, B268, C5, C10.

Ejemplo E: Ensayo *in vivo* en *Pyrenophora teres* (manchas reticulares de la cebada)

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

Las plantas de cebada (variedad Express), sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y cultivadas a 12°C, se tratan en la etapa de 1 hoja (10 cm de altura), pulverizándolas con el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente.

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

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 días. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a 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 referencia.

En estas condiciones, se observa una protección buena (de al menos 70%) con una dosis de 500 ppm con los compuestos siguientes: A2, A11, A17, A29, A30, A32, B1, B2, B6, B7, B20, B34, B36, B37, B38, B40, B41, B43, B45, B74, B75, B76, B77, B81, B82, B85, B105, B110, B111, B113, B115, B116, B123, B124, B125, B126, B127, B128, B129, B130, B131, B132, B133, B134, B135, B137, B139, B140, B141, B142, B143, B144, B145, B146, B147, B148, B149, B150, B151, B152, B153, B155, B156, B157, B158, B159, B160, B161, B162, B163, B164, B165, B166, B167, B169, B170, B171, B172, B173, B179, B180, B181, B183, B184, B186, B192, B207, B222, B237, B238, B239, B244, B252, B254, B256, B258, B260, B268, B316, C2, C4, C5, C7, C8, C9, C10, C11, C12, C16.

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

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

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

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

Después de 24 horas, las plantas se contaminaron pulverizando sus hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Puccinia recondita* (100.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de trigo contaminado de 10 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 control.

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: A5, A7, A17, A18, A25, A32, B1, B2, B6, B7, B111, B127, B129, B130, B132, B133, B146, B150, B151, B152, B157, B158, B159, B160, B161, B162, B163, B164, B165, B169, B170, B172, B186, B236, B237, B256, B316, C4, C5, C8, C9, C10, C11, C12, C16.

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

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

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

Después de 24 horas, las plantas se contaminaron pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Mycosphaerella graminicola* (500.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 7 días. Las plantas de trigo contaminadas se incuban durante 72 horas a

aproximadamente 18°C y 100% de humedad relativa y luego durante 21 a 28 días al 90% de humedad relativa.

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

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B1, B2, B33, B45, B46, B48, B64, B75, B76, B81, B85, B95, B113, B114, B116, B118, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B135, B137, B146, B151, B157, B166, B186, B192, B194, B195, B197, B226, B227, C12.

Ejemplo H

Ensayo de Leptosphaeria (trigo) / preventivo

Disolvente: 49 partes en peso de N, N-dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril-poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, los brotes se pulverizan con una preparación del compuesto activo a la dosis de aplicación indicada. Un día después de este tratamiento, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de ***Leptosphaeria nodorum***. Las plantas permanecen durante 48 horas en una cabina de incubación a 22°C y una humedad atmosférica relativa del 100%. Después, las plantas se colocan en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 22°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 90%.

Los ensayos se evaluaron 7 -9 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En esta prueba, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia del 70% o incluso mayor con una concentración de 500 ppm de ingrediente activo:

A38, B3, B4, B5, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B14, B15, B16, B17, B18, B19, B21, B22, B23, B24, B25, B26, B27, B28, B29, B57, B64, B81, B115, B116, B123, B129, B132, B133, B136, B146,

B151, B172, B187, B188, B189, B201, B202, B203, B204, B205, B206, B209, B223, B240, B241, B242, B243, B245, B246, B247, B248, B249, B250, B253, B255, B257, B259, B261, B262, B263, B264, B264, B265, B266, B267, B270, B271, B272, B273, B274, B275, B276, B277, B278, B279, B280, B281, B282, B283, B284, B285, B286, B287, B288, B289, B290, B291, B292, B293, B294, B295, B296, B297, B298, B299, B300, B301, B302, B303, B305, B307, B308, B310, B311, B312, B313, B314, B315, B317, B318, B326, B327, B328, B329, B330, B331, B332, B333, B334, B335, B336, B337, B338, B339, B340, B341, B342, B343, B344, B346, B347, B348, B349, B350, B352, B353, B354, B355, B356, B357, B358, B359, B361, B362, B363, B364, B365, B366, B367, B368, B369, B370, B371, B372, B373, B374, B375, B376, B377, B378, B379, B380, B381, B382, B383, B384, B385, B386, B387, B388, B389, B390, B391, B392, B393, B394, B395, B396, B397, B398, B399, B400, B401, C13, C14, C15, C17, C19, C20, C21, C22, C23.

Ejemplo I

Ensayo de Venturia (manzanas) / protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
24,5 partes en peso de dimetilacetamida
Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril-poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo con la dosis de aplicación indicada. Después de que se ha secado el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de conidias del agente causante de la roya de la manzana (*Venturia inaequalis*) y a continuación se deja durante 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y a una humedad atmosférica relativa de 100 %.

Después, las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 21°C y una humedad atmosférica relativa del 90%.

La prueba se evalúa 10 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 70% o incluso mayor con una concentración de 100 ppm de ingrediente activo:

A29, A30, A32, B2, B3, B4, B5, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B15, B16, B17, B19, B20, B23, B123, B129, B132, B133, B146, B151, B172, B186, B188, B203, B204, B205, B206, B209, B222, B223, B236, B238, B239, B248, B254, B255, B257, B261, B266, B268, B271, B272, B273, B274, B275, B276, B277, B278, B280, B281, B282, B285, B286, B287, B288, B289, B293, B297, B300, B310, B311, B312, B313, B315, B316, B318, B330, B331, B332, B333, B336, B337, B338, B339, B347, B349, B350, B355, B357, B358, B359, B362, B363, B364, B365, B366, B367, B368, B369, B370, B371, B372, B373, B374, B375, B379, B380, B381, B384, B386, B387, B389, B393, B393, B394, B395, B398, B399, B400, B401, C13, C14, C15, C16, C17, C19, C20, C21.

Ejemplo J

Ensayo de Uromyces (judías) / protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
24,5 partes en peso de dimetilacetamida
Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril-poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo con la dosis de aplicación indicada. Después de que se ha secado el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causante de la roya de la judía (***Uromyces appendiculatus***) y a continuación se deja durante 1 dia en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y a una humedad atmosférica relativa de 100 %.

Después, las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 21°C y una humedad atmosférica relativa del 90%.

La prueba se evalúa 10 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 70% o incluso mayor con una concentración de 100 ppm de ingrediente activo:

A29, A32, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8, B10, B11, B12, B13, B15, B16, B17, B19, B20, B23, B116, B123, B132, B133, B146, B151, B186, B209, B222, B223, B236, B238, B239, B254, B260, B261, B268, B271, B273, B274, B278, B281, B285, B286, B287, B289, B293, B295, B298, B301, B310, B311, B312, B313, B315, B316, B318, B330, B331, B332, B333, B336, B337, B338, B339, B347, B349, B350, B352, B364, B366, B367, B370, B371, B373, B374, B376, B380, B386, B390, B392, B393, B394, B395, B397, B398, B399, B400, C15, C16, C19, C21.

Ejemplo K

Ensayo de Pyricularia (arroz) / protector

Disolvente: 28,5 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1,5 partes en peso de alquilfeniléter polioxietilénico

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo con la dosis de aplicación indicada. Un día después de pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causante del tizón del arroz **(Pyricularia oryzae)**. Las plantas se colocan después en un incubador a aproximadamente 25°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100% durante 1 día.

La prueba se evalúa 5 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 80% o incluso mayor con una concentración de 250 ppm de ingrediente activo:
B1, B2, B3, B4, B6, B7, B10, B81, B116, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B141, B151, B159, B160, B162, B169, B170, B172, B186, B187, B222, B240, B254, B256, B260, B266, B271, B278, B285, B286, B287, B288, B289, B313, B315, B318, B347, B349, B353, B359, B367, B373, B374, B375, B385, B389, B390, B394, B399, C9, C15, C16,

Ejemplo L

Ensayo de Rhizoctonia (arroz) / protector

Disolvente: 28,5 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1,5 partes en peso de alquilfeniléter polioxietilénico

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo con la dosis de aplicación indicada. Un día después de pulverización, las plantas se inocularon con una hifa del agente causante del tizón de la vaina del arroz **(Rhizoctonia solani)**. Las plantas después se colocan en un incubador a aproximadamente 25°C y una humedad atmosférica relativa del 100%.

La prueba se evalúa 4 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo los compuestos según la invención de las siguientes estructuras mostraban eficacia de 80% o incluso mayor a una concentración de 250 ppm de ingrediente activo:

B1, B2, B3, B4, B6, B7, B10, B20, B64, B74, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B135, B141, B142, B143, B144, B146, B147, B148, B149, B151, B156, B159, B160, B161, B162, B169, B170, B172, B186, B207, B238, B240, B260, B266, B271, B278, B285, B286, B287,

B288, B289, B313, B315, B318, B347, B349, B353, B359, B367, B373, B374, B385, B389, B390, B392, B394, B395, B398, B399, C9, C15, C16.

Ejemplo M

Ensayo de Cochliobolus (arroz) / protector

Disolvente: 28,5 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1,5 partes en peso de alquilfeniléter polioxietilénico

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo con la dosis de aplicación indicada. Un día después de pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causante de la mancha parda del arroz **(Cochliobolus miyabeanus)**. Las plantas se colocan después en un incubador a aproximadamente 25°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100% durante 1 día.

La prueba se evalúa 4 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 80% o incluso mayor con una concentración de 250 ppm de ingrediente activo:

B1, B2, B3, B4, B6, B7, B10, B20, B64, B74, B116, B123, B124, B125, B126, B127, B129, B132, B133, B134, B135, B141, B142, B143, B144, B146, B147, B148, B151, B153, B156, B159, B160, B161, B162, B169, B170, B172, B186, B187, B238, B240, B254, B256, B260, B266, B268, B271, B278, B285, B286, B287, B288, B289, B313, B315, B318, B347, B349, B353, B359, B367, B373, B374, B375, B385, B389, B390, B392, B394, B395, B398, B399, C9, C15, C16.

Ejemplo N

Ensayo de Phakopsora (soja) / protector

Disolvente: 28,5 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1,5 partes en peso de alquilfeniléter polioxietilénico

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo con la dosis de aplicación indicada. Un día después de pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causante de la roya de la soja **(Phakopsora pachyrhizi)**. Las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa del 80%.

La prueba se evalúa 11 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 80% o incluso mayor con una concentración de 500 ppm de ingrediente activo:
A17, B3, B129, B132, B133, B186, B209, B287, B366, B371, C9.

Ejemplo O

Ensayo de Fusarium nivale (var. majus) (trigo) / preventivo

Disolvente: 49 partes en peso de n,n-dimetilacetamida
Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril-poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo o de la combinación de compuestos activos con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, las plantas jóvenes se pulverizan con la preparación de compuesto activo o combinación de compuestos activos a la dosis indicada de aplicación. Una vez que el recubrimiento pulverizado se ha secado, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de ***Fusarium nivale (var. majus)***. Las placas se colocan en un invernadero en campanas de incubación traslúcidas a una temperatura de aproximadamente 10°C y a una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100%.

La prueba se evalúa 5 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 70% o incluso mayor con una concentración de 1000 ppm de ingrediente activo:

A29, A30, A38, B1, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B14, B15, B16, B17, B18, B19, B21, B23, B81, B116, B123, B129, B132, B133, B146, B151, B172, B186, B201, B203, B204, B205, B206, B209, B223, B240, B241, B242, B245, B253, B255, B261, B266, B267, B271, B272, B273, B274, B277, B278, B284, B285, B286, B287, B288, B289, B290, B293, B295, B297, B299, B300, B314, B316, B317, B317, B318, B347, B349, B352, B353, B355, B359, B359, B373, B373, B374, B375, B376, B382, B385, B387, B388, B389, B390, B394, B397, B398, B399, C13, C13, C16, C17, C17, C19, C20, C21.

Ejemplo P

Ensayo de Puccinia triticina (trigo) / preventivo

Disolvente: 49 partes en peso de n,n-dimetilacetamida
Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril-poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo o de la combinación de compuestos activos con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, las plantas jóvenes se pulverizan con la preparación de compuesto activo o combinación de compuestos activos a la dosis indicada de aplicación. Una vez

que el recubrimiento pulverizado se ha secado, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de ***Puccinia triticina***. Las plantas se dejan estar 48 horas en una incubadora a aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100%. Después, las plantas se colocan en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80%.

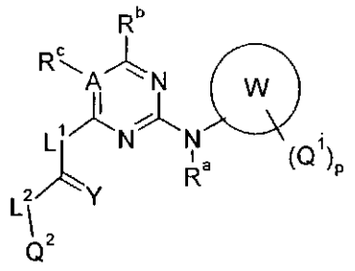
La prueba se evalúa 8 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la de la referencia, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa ninguna enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia de 70% o incluso mayor con una concentración de 1000 ppm de ingrediente activo:

A29, A32, A38, B1, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B15, B16, B17, B18, B19, B123, B129, B132, B133, B146, B151, B172, B186, B201, B209, B247, B248, B261, B266, B272, B273, B274, B276, B278, B281, B284, B285, B286, B287, B288, B289, B290, B292, B293, B297, B299, B300, B314, B316, B317, B318, B347, B350, B352, B353, B355, B359, B364, B370, B371, B373, B374, B375, B376, B382, B385, B387, B389, B394, B397, B398, C13, C16, C17, C17, C19, C21.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de piridil-azinilamino sustituido de fórmula (I)



(I)

en los que

- W representa fenilo o un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- A representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno con la condición de que si A representa un átomo de carbono entonces W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes
- Q^1 representa independientemente un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo(C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-cicloalquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-

(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilisulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo o fenilamino; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alcoxialquilo C_1-C_8 o un halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxialquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxialquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquiltioalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;
- R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C_1-C_8, un cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1

a 5 átomos de halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- L^1 representa un resto piridilo sustituido o no sustituido;
- Y representa O, S, NR^d, CR^eR^f;
- L^2 representa un enlace directo, O, S, NR^g, CR^hR^i;
- Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6, alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6),

alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- Alternativamente, L2 y Q2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;
- R^d, R^e, R^f, R^g, R^h y R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalqulsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3-C_8, halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbamoilo, di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)oxicarbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquil C_1-C_8)oxicarboniloxi, alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-

C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible;

- Salvo que se indique lo contrario, un grupo o un sustituyente que está sustituido, está sustituido con uno o más de los siguientes grupos o átomos: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ^6-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)silil-(cicloalquilo C_1-C_8), un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alqueniloxi C_2-C_8, un alquiniloxi C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C_2-C_8, un halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C_3-C_8, un halogenoalquiniloxi C_3-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbamoilo, un di-(alquil C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquiloxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un N-(alquil C_1-C_8)-(alcoxi C_1-C_8)carbamoilo, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonil que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carboniloxi, un (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un (alquiloxi C_1-C_8)carboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquisulfonilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfonilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de

halógeno, un alquilaminosulfamoilo C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)aminosulfamoilo, un (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, o fenilamino;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides e isómeros ópticamente activos o geométricos; con la condición de que estén excluidos los compuestos siguientes:

- (3-{[4-(2-etenilpiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}fenil)metanol;
- 4-{4-[(3-{2-[(terc-butoxicarbonil)amino]etoxi}fenil)amino]-1,3,5-triazin-2-il}-piridina-2-carboxilato de metilo;
- N-{3-[(4-{2-[(1Z)-3-amino-2-cloroprop-1-en-1-il]piridin-4-il}-1,3,5-triazin-2-il)amino]-bencil}-N-metilglicina.

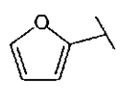
2. Un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, en el que W representa un fenilo y A representa un átomo de nitrógeno.

3. Un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, en el que W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes.

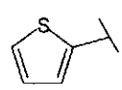
4. Un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, en el que A representa un átomo de nitrógeno y W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes.

5. Un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, en el que A representa un átomo de carbono y W representa un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes.

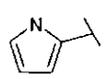
6. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 5, en la que W representa fenilo o un heterociclo aromático o no aromático, saturado o insaturado, seleccionado de la lista que consiste en:

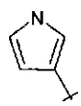

Het-1 ;

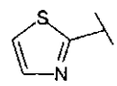

Het-2 ;

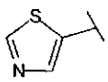

Het-3 ;

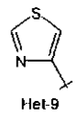

Het-4 ;

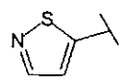

Het-5 ;

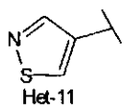

Het-6 ;

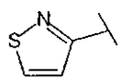

Het-7 ;

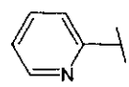

Het-8 ;

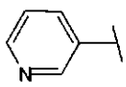

Het-9 ;

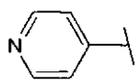

Het-10 ;


Het-11


Het-12


Het-13 ;


Het-14


Het-15 ;

7. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 6, en el que Q^1 representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo (hidroxiimino)-(alquilo C^1-C_6), un alquilo C_1-C_8, un tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, un alquinilo C_2-C_8, un alquilamino C_1-C_8, un di-(alquil C_1-C_8)amino, un alcoxi C_1-C_8, un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, un (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)carbonilamino, un (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, un alquilsulfenilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_8, un halogenoalquilsulfinilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de

halógeno; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible.

8. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 o 7, en la que p representa 0, 1, 2 ó 3.

9. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 8, en la que p representa 1.

10. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 9, en la que R^a representa un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido.

11. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 10, en la que R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

12. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 11, en la que R^b y R^c representan independientemente un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

13. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 12, en la que R^d a R^i representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxi, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, tri(alquil C_1-C_8)sililo, tri(alquil C_1-C_8)silil-(alquilo C_1-C_8), cicloalquilo C_1-C_8, halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2-C_8, alquiniloxi C_2-C_8, alquilsulfanilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carboniloxi, (halogenoalquil C_1-C_8)carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, di-(alquil C_1-C_8)aminocarboniloxi, (alquiloxi C_1-C_8)carboniloxi,

alquilsulfenilo C_1-C_8, halogenoalquilsulfenilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), fenilamino, fenilheteroarilamino o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible.

14. Un compuesto de de formula (I) según las reivindicaciones 1 a 13, en la que R^d representa H, (metoxicarbonil)amino, (4-clorofenil)amino, [3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]amino, (2-etoxi-2-oxoetil)amino, (2,2,2-trifluoroetil)amino, (2-cianoetil)amino, metilamino, (2-metilpropanoil)oxi, (3-metilbut-2-enoil)oxi, (3-metilbutanoil)oxi, butanoiloxi, propanoiloxi, (metoxiacetil)oxi, acetiloxi, ciclopentiloxi, diciclopropilmetoxi, 1-ciclopropiletoxi, but-3-in-2-iloxi, hex-2-in-1-iloxi, but-2-in-1-iloxi, prop-2-in-1-iloxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, (2,6-diclorobencil)oxi, (4-clorobencil)oxi, (4-metoxibencil)oxi, benciloxi, ciclopropilmetoxi, 2-metilpropoxi, prop-2-en-1-iloxi, propoxi, 2-(dimetilamino)etoxi, etoxi, metoxi, hidroxilo, fenilamino o fenilheteroarilamino.

15. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 14, en la que R^9 representa hidrógeno, prop-2-en-1-ilo, hexilo, butilo, propilo, 2-hidroxietilo, etilo, metilo.

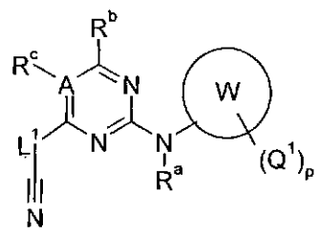
16. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 15, en la que L^1 se selecciona en la lista consistente en:

18. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 17, en la que Q^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxi, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, grupo (hidroxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_8, cicloalquilo C_1-C_8, halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_8, alquinilo C_2-C_8, alquilamino C_1-C_8, di-(alquil C_1-C_8)amino, alcoxi C_1-C_8, halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfanilo C_1-C_8, (alquil C_1-C_8)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (halogenoalcoxi C_1-C_8)carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alquil C_1-C_8)carbonilamino, (halogenoalquil C_1-C_8)carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C_1-C_6-)-(alquilo C_1-C_6), (alqueniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (alquiniloxiimino C_1-C_6)-(alquilo C_1-C_6), (2-oxopirrolidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8-alquilo), (2-oxopirrolidin-1-il)-(halogenoalquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxopiperidin-1-il)-(halogenoalquil C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il)-(alquilo C_1-C_8), (2-oxoazepan-1-il)-(halogeno alquilo C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-(alquilo C_1-C_6), alcoxialquilo C_1-C_8, halogenoalcoxialquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfanilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfanilo, fenilamino, o un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, o un (heterociclil de 4, 5, 6 ó 7 miembros)-(alquilo C1-C6) que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; pudiendo estar sustituidos cada uno de estos grupos o sustituyentes, cuando sea químicamente posible; o
L^2 y Q^2 pueden formar juntos un heterociclo de 4, 5, 6 ó 7 miembros no aromático, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados en la lista consistente en N, O, S.

19. Un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 18, en la que Q^2 representa (2R)-2-(metoximetil)pirrolidin-1-ilo, (2S)-1-metoxipropan-2-ilo, 1-(dietilamino)propan-2-ilo, 1-(dimetilamino)propan-2-ilo, 1,1-dioxidotetrahidrotiofen-3-ilo, 1,3-dimetoxipropan-2-ilo, 1-cianobutan-2-ilo, 1-ciclopropil-2-metoxietilo, 1-etilpiperidin-3-ilo, 1-metoxibutan-2-ilo, 1-metoxipropan-2-ilo, 2-(hidroximetil)piperidin-1-ilo, 2-(morfolin-4-il)etilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,3-dimetilpiperidin-1-ilo, 2,5-dimetilpirrolidin-1-ilo, 2,6-dimetilmorfolin-4-ilo, 2-cianoetilo, 2-etilpiperidin-1-ilo, 2-hidroxi-2-metilpropilo, 2-hidroxietilo, 2-metoxietilo, 2-metilpiperidin-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metilpropilo, 2-metilpirrolidin-1-ilo, 3-(2-

oxoazepan-1-il)propilo, 3-(2-oxopirrolidin-1-il)propilo, 3-(formilamino)propilo, 3-(hidroximetil)piperidin-1-ilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3-dimetilpiperidin-1-ilo, 3,5-dimetilpiperidin-1-ilo, 3,6-dihidropiridin-1(2H)-ilo, 3-hidroxipiperidin-1-ilo, 3-hidroxipropilo, 3-hidroxipirrolidin-1-ilo, 3-metoxibutan-2-ilo, 3-metoxipiperidin-1-ilo, 3-metoxipropilo, 3-metilbut-2-en-1-ilo, 3-metilbutan-2-ilo, 3-metilbutilo, 3-metilpiperidin-1-ilo, 4-(2-oxopirrolidin-1-il)butilo, 4-(trifluorometil)piperidin-1-ilo, 4-cianopiperidin-1-ilo, 4-etoxiciclohexilo, 4-formilpiperazin-1-ilo, 4-hidroxipiperidin-1-ilo, 4-metoxipiperidin-1-ilo, 4-metilpiperazin-1-ilo, 4-metilpiperidin-1-ilo, 4-oxoimidazolidin-1-ilo, azepan-1-ilo, butan-2-ilo, butilo, ciclobutilo, ciclohexilo, ciclopentilo, ciclopropilo, ciclopropilmetilo, etilo, hidrógeno, hexilo, hidroxi, metoxi, metilo, morfolin-4-ilo, oxetan-3-ilo, pentan-2-ilo, pentan-3-ilo, pentilo, piperidin-1-ilo, prop-2-en-1-ilo, propan-2-ilo, propilo, pirrolidin-1-ilo, terc-butilo, tetrahidrofuran-2-ilmetilo, tiomorfolin-4-ilo.

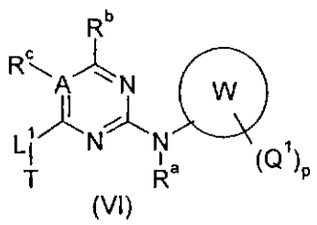
20. Un compuesto de fórmula (V) útil como compuesto intermedio o material para la preparación de un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 19



(V)

en la que W, A, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 se definen como en las reivindicaciones 1 a 18.

21. Un compuesto de fórmula (VI) útil como compuesto intermedio o material para preparar un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1 a 19



(VI)

en la que W, A, Q^1, p, R^a, R^b, R^c, L^1 son como se definen en las reivindicaciones 1 a 18, y T representa un átomo de cloro, con la condición de que los siguientes compuestos están excluidos:

- N-(3-clorofenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina
- 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina
- 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3,4,5-trimetoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina

22. Un compuesto de fórmula (VI) según la reivindicación 21, seleccionado del grupo constituido por 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(piridin-3-il)pirimidin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-metoxipiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3,4,5-trimetoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina, ácido 3-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}benzoico, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(6-cloropiridin-2-il)pirimidin-2-amina, N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-(1-metoxibutan-2-il)piridina-2,4-diamina, N-(3-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(metilsulfanil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, N-(3-cloro-4-metilfenil)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-ciclobutilpiridina-2,4-diamina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-(3-metilbutan-2-il)piridina-2,4-diamina, N^4-[4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-il]-N^2-(pentan-3-il)piridina-2,4-diamina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(piridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 3-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}tiofeno-2-carboxilato de metilo, 2-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}-4-metil-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(4-metil-1,3-tiazol-2-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(5-metil-1,3-tiazol-2-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(2-metilpiridin-4-il)pirimidin-2-amina, N-(2-bromopiridin-4-il)-4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina, N-(5-bromopiridin-3-il)-4-(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[2-(trifluorometil)piridin-4-il]pirimidin-2-amina, 2-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}tiofeno-3-carbonitrilo, N-(5-cloro-3-metilpiridin-2-il)-4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(4-cloropiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(2-metilpiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-amina, N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)-N-(metoximetil)pirimidin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(2,5-difluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3-fluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(metoximetil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(tiofen-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(trifluorometil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(propan-2-il)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(trifluorometoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(pentafluoro-lambda^6-sulfanil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3-etoxifenil)-1,3,5-

triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(3-metoxifenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-fenil-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-(4-fluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina, 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(difluorometoxi)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina, N-(3-{[4-(2-cloropiridin-4-il)-1,3,5-triazin-2-il]amino}fenil)acetamida, y 4-(2-cloropiridin-4-il)-N-[3-(difluorometil)fenil]-1,3,5-triazin-2-amina.

23. El uso de un compuesto definido en las reivindicaciones 20 a 22, como un compuesto intermedio o material para preparar un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 19.

24. Una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 19 y un soporte, vehículo o carga aceptable desde un punto de vista agrícola.

25. Un método para reprimir los hongos fitopatógenos de cultivos agrícolas, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz desde el punto de vista agronómico y sustancialmente no fitotóxica, de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 19 o de una composición según la reivindicación 24, al suelo en el que crecen o pueden crecer las plantas, a las hojas y/o a los frutos o a las semillas de las plantas.

26. Un método para combatir hongos productores de fitopatógenos y micotoxinas, caracterizado porque se aplica un compuesto según la reivindicación 1 a 19 o una composición según la reivindicación 24, a estos hongos y/o su hábitat.

ARCHIVADO EL 13 DE AGOSTO 2010
RADICACION N: 10-099960

Traducción Oficial Inglés-Español Bayer CropScience AG

Poder de Abogado
Ver Traducción al español en el documento original adjunto.
Dado y firmado en
El 12 de Marzo de 2008

No. 388 del registro del documento para el 2008

Por la presente verifico las firmas de

Dr. Robert Krieg
y
Dr. Alexander Nowak

cuya dirección registrada es como sigue:

Bayer CropScience AG
Planificación y Administración de Negocios
Legales & Patentes
Patentes y Licencias
Building 6100
Alfred-Noble Straße 50
40789 Monheim, Alemania

quienes son individualmente representantes autorizados de Bayer CropScience AG y a quienes conozco personalmente

que fueron suscritas ante mí en la página anterior debajo del nombre impreso de la compañía; y confirmo que después de inspeccionar el registro comercial del tribunal local de Dusseldorf, están registrados en la Sección HRB 46985 como representantes individualmente autorizados.

También certifico que Bayer CropScience AG, involucrada en esta certificación, es una compañía activa y existente como entidad legal.

Leverkuseen, Marzo 12 de 2008

Sellos: 1) sello lacrado blanco en alto relieve que dice: KLAUS STRIEWSKI – NOTARIO EN LEVERKUSEN
2) sello impreso en azul que dice: KLAUS STRIEWSKI – NOTARIO EN LEVERKUSEN

Sigue Apostilla en alemán con traducción oficial adjunta

AUTENTICACIÓN DE COPIA DE ORIGINAL
13 AGO 2010
RODOLFO RET BERMUDEZ
Notario Único del Círculo de Bogotá D.C.

Resolución 6694/78 Minjusticia

Clemencia Posada Tejada
TRADUCTORA OFICIAL
ENGLISH - FRENCH - SPANISH
ANGLAIS - FRANÇAIS - ESPAGNOL

APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. País: Rep. Federal de Alemania

El presente documento público

2. ha sido firmado por Klaus Striewski

3. actuando en calidad de: notario público

4. lleva el sello / estampilla de: notario Klaus Striewski en Leverkusen

Certificado

5. en: Colonia

6. el: 20 de marzo de 2008

7. por: el vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No.: 1424/08

9. Sello:

10. Firmado:

el presidente del Tribunal Regional
de Colonia

Caliebe

Recibí por este derechos judiciales
por valor total de 69.02 Euros *

AUTENTICACIÓN DE COPIA DE ORIGINAL
EL SUSCRITO NOTARIO TRIGÉSIMO OCTAVO DEL CÍRCULO CERTIFICA
QUE LA PRESENTE COPIA CONCUERDA FIELMENTE CON
EL DOCUMENTO ORIGINAL QUE TUVE A LA VISTA.
13 AGO 2010
38
RODOLFO REY BERMUDEZ
Notario 38(E) DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C.

Adolf Watzke
Traductor oficial
Res. 2433 Min. Justicia

N - L - [illegible]

BAKER & MCKENZIE

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

NIT: 900.034.906-9
Tel: +57 1 634 1500
Fax: +57 1 376 2211
www.bakernet.com

POWER OF ATTORNEY

The undersigned,

BAYER CROPSCIENCE AG

domiciled in

Alfred-Nobel-Strasse 50,
40789 Monheim Am Rhein
Germany

declares that it hereby grants to

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

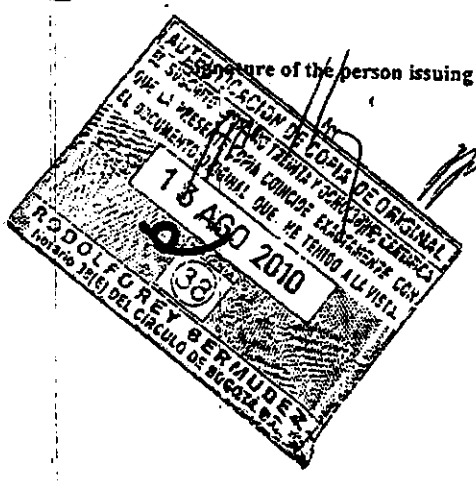
with domicile at Av. 82 No. 10 – 62, 6Th floor, of Bogotá D. C., Colombia, a full and sufficient power of attorney to obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities 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.

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

Done and subscribed in

On the 12 th day of March of 2008

Signature of the person issuing the Power



PODER DE ABOGADO

La abajo firmada,

BAYER CROPSCIENCE AG

domiciliada en

Alfred-Nobel-Strasse 50,
40789 Monheim Am Rhein
Alemania

declara por el presente que otorga a

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

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.

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

Dado y firmado en

A los 12 días del mes de Marzo de 2008

Firma de la persona que firma el Poder

No. 388 of the document register for 2008

I herewith verify the signatures of

Dr. Robert Krieg
and
Dr. Alexander Nowak

of the following business address:
Bayer CropScience AG
Business Planning and Administration
Law & Patents
Patents and Licensing
Building 6100
Alfred-Nobel-Straße 50
40789 Monheim, Germany

who are severally authorised representatives of
Bayer CropScience AG and are known personally to me

which were subscribed today in my presence of the previous page beneath the typewritten company name and confirm that, having today inspected the commercial register of the local court in Düsseldorf, are recorded in Section HRB 46985 as severally authorised representatives.

I verify that Bayer CropScience AG involved in this certification is active and exists as legal entity.

Leverkusen, den 12. März 2008

Notary Public

KLAUS STRIEWSKI
NOTAR IN LEVERKUSEN

AUTENTICACION DE COPIA DE ORIGINAL
EL SUSCRITO NOTARIO TREINTA Y OCHO (38) DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C. CERTIFICA
QUE LA PRESENTE COPIA COINCIDE EXACTAMENTE CON
EL DOCUMENTO ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA.
13 AGO 2010
(38)
RODOLFO REY BERMUDEZ
Notario Treinta y Ocho (38) del Circulo de Bogotá D.C.

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

   Diese öffentliche Urkunde

2. ist unterschrieben von **Klaus Striewski**

3. in seiner Eigenschaft als **Notar**

4. Sie ist versehen mit dem Siegel des
   Notars Klaus Striewski in Leverkusen

Bestätigt

5. in Köln
6. am 20.03.2008
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln
8. unter Nr. 1424/08
9. Stempel
10. Unterschrift

Caliebe

AUTENTICACION DE COPIA DE ORIGINAL
EL SUSCRITO NOTARIO TRAMITA Y DOCUMENTO CERTIFICA
QUE LA PRESENTE COPIA CORRESPONDE EXACTAMENTE CON
EL DOCUMENTO ORIGINAL QUE SE PRESENTO A LA VISTA
13 AGO 2010
RODOLFO PEREZ BERMUDEZ
Notario 38(e) DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C.

EUR 10.00
10.00
3.00
25.00
58.00
11.02
EUR 69.02

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios: 133

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
[redacted]
No. 11-058071- -00000-0000
Fecha: 2011-05-11 17:21:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 339

PATENTE DE INVENCIÓN ☐ **MOD**

- ☐ Indicación que se solicita una p:
- ☐ Datos de identificación del solici.
- ☐ 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 INVENCIÓN PCT ☒ **MODELO DE UTILIDAD PCT** ☐ **Art.33 Decisión 486/00, Circular Única**

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

Completa ☑ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐ **(Art. 119 Decisión 486/00)**

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

Completa ☐ Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐ **(Art. 92 Decisión 486/00)**

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

Completa ☐ Incompleta ☐

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CORREA ORDOÑEZ ALVARO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPSCIENCE AG

REFERENCIA	Radicación No.	11 58071
	Solicitud internacional	PCT/EP2009/65018
	Fecha inicio fase nacional	13/06/2011
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	1 1 4 9

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

1. Con respecto al resumen y de conformidad con lo dispuesto en el artículo 31 D. 486 en el cual se establece que el resumen consiste en una síntesis de la divulgación técnica contenida en la solicitud de patente, debe adecuar el resumen a los dispuesto en dicha norma, teniendo en cuenta que el extracto permitirá precisar el objeto de la invención, sus elementos característicos y el campo de aplicación.

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

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

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

Continua en la página siguiente...