

OP



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PC-7
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. 06.8282

54. TITULO "NUEVOS COMPUESTOS 2-PIRIDINILETILBENZAMIDA"

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL COD 213/00 Adm 43/40

71. SOLICITANTE BAYER CROSCIENCE S.A.

DOMICILIO LYON, FRANCIA

74. APODERADO ALVARO CORREA OROPEZ
TP.20-281

22. BOGOTA, D.C., ENERO 30, 2006

~~100-807~~ 1

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
 Radicación : 06000202 00000000 Folios: 102
 Fecha (MM): 2000-01-20 16:55:47 ción
 Trámite : 011 PCT-PATENT 370 FASE MARC 411 PRESENTN
 Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

① ☒ Patente de Invención ☒ Capítulo I. SOLICITUD DE : ☐ Patente de Modelo de Utilidad ☐ Capítulo II.	
---	--

② SOLICITANTE (71)	Nombre: BAYER CROPS SCIENCE S.A.	IDENTIFICACION	
	Dirección: 16, rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon, Francia	C.C. ☐	NIT ☐
Nacionalidad o Domicilio: Francesa	C.E. ☐	Otro ☐	
Lugar de Constitución: Lyon, Francia	Teléfono:	Fax:	Cual _____
E-Mail:	Número _____		

3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ	IDENTIFICACION	
	Dirección Avenida 82 No.10-62 Piso 6o. Teléfono: 634 1500 Fax: 376 2211 E-Mail: patents.bogota@bakernet.com	C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número 79.143.366 de Usaquén TP 20.281	

4 INVENTOR (ES) (72)	Nombre: MANSFIELD, Darren James; COQUERON, Pierre-Yves; DESBORDES, Philippe; RIECK, Helko, GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; GENDX, Pierre; VILLIER, Alain y CHRISTIAN, Isabelle Dirección: 25 montee Bonafous, F-69004, Lyon, Francia; 36 Rue de la tete d'Or, F-69006 Lyon, Francia; 30 Rue Bancel, F-69007, Lyon, Francia; 9, rue Claude Monet, F-69110 SAINTES FOY-LES-LYON, Francia; Le TrSve Colonge Route d'Albigny, F-69250 CURIS AU MONT D'OR, Francia; 14, Rue Duviard, F-69004, Lyon, Francia; 3 Chemin des Garennes, F-69450 SAINT CYR AU MONT D'OR, Francia y 48, rue Saint Jean, F-69005 Lyon, Francia. Nacionalidad o Domicilio: Británico; Francés; Francés; Francés; Francesa; Francés; Francés y Francesa
--	---

5	PCT (85)		
	Solicitud Internacional N ^o .	<u>PCT/EP2004/009145</u>	Fecha <u>Julio 19, 2004</u>
	Publicación Internacional N ^o .	<u>WO 2005/014545 A2</u>	Fecha <u>Febrero 17, 2005</u>

⑥ Título (54) NUEVOS COMPUESTOS 2-PIRIDINILETILBENZAMIDA.

7 Clasificación Internacional (51) C07D 213/00

8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>EP</u> 	(32) Fecha <u>Julio 25, 2003</u> 	(31) Número de Solicitud <u>03356116.8</u>
---	---	--	--

9 Comprobante de pago No. 05-32,487 y 05-71,288 Fecha 04-MAY-05 y 15-SEP-05

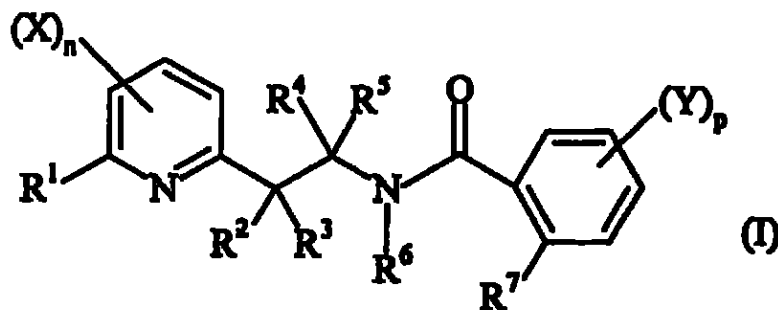
10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, el fuere el caso
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud Internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud Internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar Internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)
- ☐ Traducción del examen preliminar Internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☐ Arte final 12 x 12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud Internacional.
- ☐ Otros:

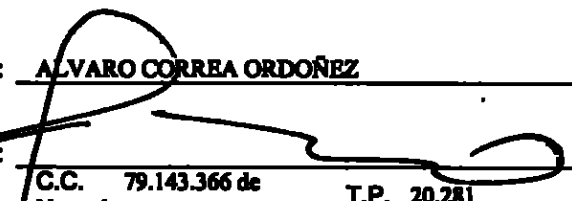
11

FIGURA CARACTERISTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDOÑEZFIRMA: C.C. 79.143.366 de
Usaquén

T.P. 20.281

000003

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 06000202 00000000 Folios: 102
Fecha (AMD): 2006-01-30 16:35:47
Tramite : 011 PCT-PATENT 370 FASE NNCI 411 PRESENTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000176009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 32,467
FECHA : MAYO 4 DE 2005

CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CORREA ORDONEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	37739480	04/05/2005	96,012,000.00

CONCEPTO

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50003-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	443,000.00
		TOTAL :	443,000.00

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 05000202 00000000

Folios: 182

Fecha (HNB): 2005-01-20 16:55:47

Tramite : 011 PCT-PATENT 378 FASE INICI 411 PRESENTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 5 - 71,299

FECHA : SEPTIEMBRE 15 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

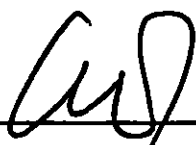
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CORREA ORDOEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	27350373	15/09/2005	78,736,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMI	20,000.00
		TOTAL :	20,000.00

SOM: VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL ASUNTO No.

POD-02638

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

APOSTILLA EN PODER DE BAYER CROPSCIENCE SA

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

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

Al reverso:

APOSTILLA

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

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

CERTIFICADO

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

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

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

6- La certificaciones 3.4 y 5 se basan en: Página de la Gaceta "anuncios judiciales y legales" del periódico "Le Totit Lyon- Monteur Judiciaire Reunis", fechado el 21 al 27 de junio de 2003.

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

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

APOSTILLA

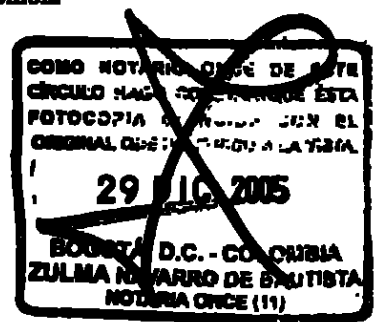
(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)- Colombia

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

CERTIFICADO

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

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



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

BAYER & M. R. R. R.

Raisbeck, Lara, Rodríguez & Rueda
Av. 82 No. 10 - 62 Pto 6
Bogotá, Colombia

NT: 880.088.840-3
Tel: +57 1 694 1800
Fax: +57 1 378 2211
www.bakermet.com

POWER OF ATTORNEY

The undersigned.

BAYER CROPSCIENCE SA

domiciled in

18, rue Jean-Marie Leclair
69008 LYON, France

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, especially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtaining 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
Lyon

On the
February 11th, 2005 day of

Alexander NOWAK


PODER

La abajo firmada,

BAYER CROPSCIENCE SA

domiciliada en

16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France

declara por el presente que otorga a

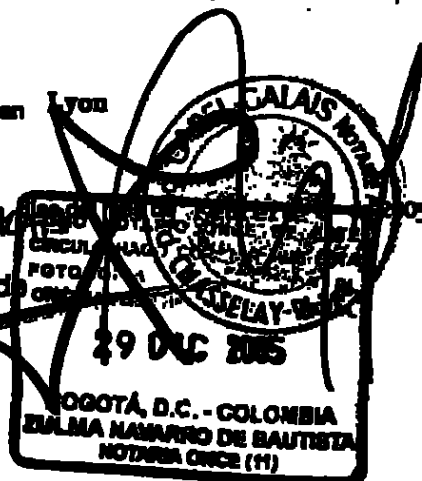
**ALVARO CORREA-ORDOÑEZ and/or OLGA GEORGETTE
OTERO and/or RICARDO METKE and/or JUAN PABLO
CONCHA.**

con domicilio en la Av. 82 No. 10 - 62 Pto 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, lamas 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 oficiales.

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

Dado y firmado en Lyon

Je soussigné M. **ALEXANDER NOWAK**
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
M. **Alexander NOWAK**
qui a été apposée
Chasselay, le 15/02/2005



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Claude

1. — République française

Le présent acte public

2. — a été fait par GAREL Germain, Patrice

3. — en sa qualité de Notaire

4. — en vertu de sa fonction.

Chasselay (20)

Atteste

5. — le 16/12/05

6. — par le Procureur général près la cour d'appel

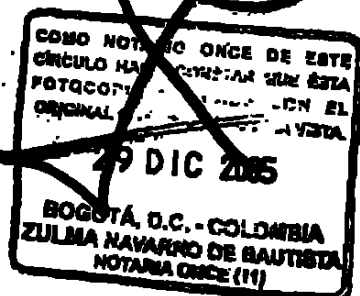
7. — sous n° 293

8. — en vertu de sa fonction.

10. — Signature



[Handwritten signature]



NOTARIAL CERTIFICATION

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

CERTIFIES**Alexander NOWAK**

1. That _____
of legal age and domiciled in Neunhause Waj 10,
51467 Bergisch Gladbach, Germany
set his hand on the foregoing document.
2. That the grantor is to me personally known and that he/she has legal capacity to execute the instrument.
3. That the grantor has executed the foregoing document as
Authorized Representative
of the judicial person Bayer CropScience S.A.
4. That the judicial person Bayer CropScience S.A.
having its home office in 16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France
is duly organized, has present legal existence and that the purposes for which the power of attorney is granted are within the scope of its corporate purposes.
5. That the grantor has in fact the referred to authority and that his/her representation is legal.
6. That I have based certifications 3, 4 and 5 above on the following authentic documents for such purpose exhibited to me and which I mention specifically, giving their dates and their origin or source:

-Page "annonces judiciaires et légales" from the newspaper "Le Tout Lyon-Moniteur Judiciaire
Reunis" dated 21 to 27 June 2003
-Power of Attorney from Bayer CropScience SA (from the Chairman of the Management Board) dated 15 October 2004

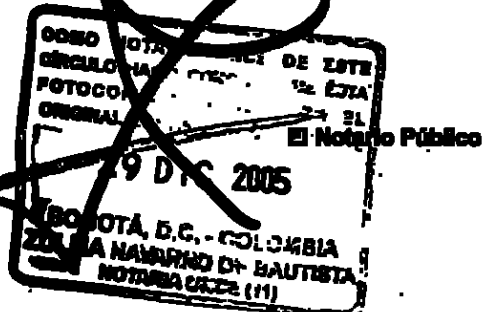
Notary Public

CERTIFICACION NOTARIAL

A los 10 días del mes de Marzo
de 200 5, el suscrito Notario

DA FE**Alexander NOWAK**

1. Que _____
mayor y domiciliado en Neunhause Waj 10,
51467 Bergisch Gladbach, Alemania
suscribió de su puño y letra el documento que antecede.
2. Que conozco al otorgante y que éste tiene capacidad legal para el otorgamiento.
3. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de
Representante Autorizado
de la persona jurídica Bayer CropScience S.A.
4. Que la persona jurídica Bayer CropScience S.A.
con sede en 16, rue Jean-Marie Leclair
69009 Lyon, Francia
está legalmente constituida, que tiene existencia legal actual y que el acto para el cual se otorga el poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.
5. Que el otorgante tiene efectivamente la representación que ostenta y que ésta es legítima.
6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhibieron y que menciono específicamente con expresión de sus fechas y de su origen o procedencia:



APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Colombie

1. — République Française
Le présent acte public

2. — a été signé par BOREL Gillys Cédric

3. — agissant en qualité de avocat

4. — est revêtu du sceau de son étude à
Antelero (Noua)

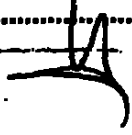
Attesté

5. — à Noua le 18 Mars 2005

7. — Par le Procureur général près la cour d'appel

8. — sous le n° 151

10. — Signature

COMO NOVEDO EN LA CITA
CIRCULO N.º 10
FOTOCOPIA
ORIGINAL

29 DIC 2005

BOGOTÁ, D.C. - C.C. COPIA
ZULMA HERNANDEZ DE RAMIREZ
NOTAS DE LEGALIZACIÓN

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

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
17 February 2005 (17.02.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/014545 A2

(51) International Patent Classification⁷: C07D 213/00

(21) International Application Number:
PCT/EP2004/009145

(22) International Filing Date: 19 July 2004 (19.07.2004)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
03356116.8 25 July 2003 (25.07.2003) EP

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

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): MANSFIELD, Darren James [GB/FR]; 25 montee Bonafous, F-69004 LYON (FR). COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 36 Rue de la tete d'Or, F-69006 LYON (FR). DESBORDES, Philippe [FR/FR]; 30 Rue Bancel, F-69007 LYON (FR). RIECK, Helko [DE/FR]; 9, rue Claude Monet, F-69110 SAINTE FOY-LÉS-LYON (FR). GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR]; Le TrSve Collonge, Route d'Albigny, F-69250 CURIS AU MONT D'OR (FR). GENDX, Pierre [FR/FR]; 14, Rue Daviard, F-69004 LYON (FR). VILLIER, Alain [FR/FR]; 3 chemin des Garennes, F-69450 SAINT CYR AU MONT D'OR (FR). CHRISTIAN, Isabelle [FR/FR]; 46, rue Saint Jean, F-69005 LYON (FR).

(74) Agent: MERIGEAULT, Shona; BAYER CROPSCIENCE S.A., Patents & Licensing Department, 14/20 rue Pierre Baizet, BP9163, F-69263 LYON (FR).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,

CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, 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, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Declaration under Rule 4.17:

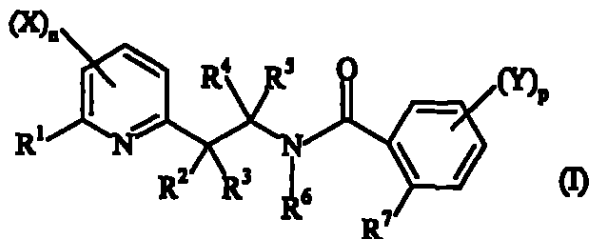
— as in applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii)) for the following designations AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO patents (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patents (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI patents (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

Published:

— without international search report and to be republished upon receipt of that report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: NEW 2-PYRIDINYLETHYLBENZAMIDE COMPOUNDS



(57) Abstract: Compound of general formula (I): Process for preparing this compound. Fungicidal composition comprising a compound of general formula (I). Method for treating plants by applying a compound of general formula (I) or a composition comprising it.

New 2-pyridinylethylbenzamide compounds

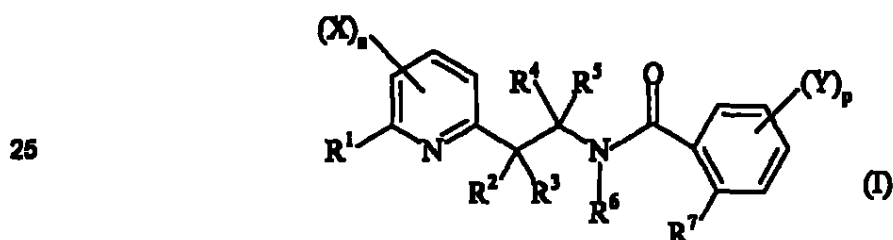
The present invention relates to novel N-[2-(2-pyridinyl)ethyl]benzamide
 5 derivatives, their process of preparation, their use as fungicides, particularly in the
 form of fungicidal compositions, and methods for the control of phytopathogenic
 fungi of plants using these compounds or their compositions.

The international patent application WO 01/11965 discloses a broad family of
 fungicidal compounds in which the 2-pyridyl group is substituted by at least one
 10 halogenoalkyl group.

It is always of high-interest in agriculture to use novel pesticidal compounds
 in order to avoid or to fight the development of resistant strains to the active
 ingredients used by the farmer. It is also of high-interest to use novel compounds
 being more active than those already known, with the aim of decreasing the amounts
 15 of active material to be used by the farmer, whilst at the same time maintaining an
 effectiveness at least equivalent to the already known compounds.

We have now found a new family of compounds which possess the above
 mentioned characteristics.

20 Accordingly, the present invention relates to N-[2-(2-
 pyridinyl)ethyl]benzamide derivative of general formula (I):



in which :

- n is 1, 2 or 3;
- X is the same or different and is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro
 30 group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a
 pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino
 group, a carboxy group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a
 carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₈-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-
 35 alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-
 alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulfanyl,

a C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a (N-C₁-C₈-alkyl)oxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a (N-C₁-C₈-alkyl)-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphiridyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a (C₁-C₈-alkoxyimino)-C₁-C₈-alkyl, a (C₁-C₈-alkenyloxyimino)-C₁-C₈-alkyl, a (C₁-C₈-alkynyloxyimino)-C₁-C₈-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₈-alkyl, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl or a phenylamino;

- R¹ is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₈-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulfanyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-

- alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₆-alkylsulphenyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylsulphanyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulphanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylsulphonyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a benzyloxy, a benzylsulfanyl optionally substituted with 1 to 5 halogen atoms, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl optionally substituted with 1 to 5 halogen atoms or a phenylamino;
- with the proviso that X and R¹ are not both a hydrogen atom;
- 10 - R² and R³ are the same or different and are a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a hydroxy group, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenyl, a C₁-C₆-alkoxy, a C₁-C₆-alkylsulfanyl, a C₁-C₆-alkylsulfenyl, a C₁-C₆-alkylsulfinyl, a C₁-C₆-alkoxycarbonyl, a C₁-C₆-alkylcarbonyloxy or a C₁-C₆-alkylcarbonylamino;
- 15 or R² and R³ may together form a 3-, 4-, 5- or 6-membered carbocycle;
- R⁴ and R⁵ are the same or different and are a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₆-alkyl or a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;
- or R⁴ and R⁵ may together form a 3-, 4-, 5- or 6-membered carbocycle;
- 20 - R⁶ is a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a hydroxy group, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxy, a C₁-C₆-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₃-C₆-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenyl, a C₂-C₆-alkynyl, a C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-cyanoalkyl, a C₁-C₆-aminoalkyl, a C₁-C₆-alkylamino-C₁-C₆-alkyl, a di-C₁-C₆-alkylamino-C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-alkylcarbonyl, a C₁-C₆-halogenalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkyloxycarbonyl, a C₁-C₆-benzyloxycarbonyl, a C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkylcarbonyl, a C₁-C₆-alkylsulfonyl or a C₁-C₆-halogenoalkylsulfonyl having 1 to 5 halogen atoms;
- 25 - p is 1, 2, 3 or 4;
- 30 - Y is the same or different and is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenyl, a C₂-C₆-alkynyl, a C₁-C₆-alkylamino, a di-C₁-C₆-alkylamino,
- 35 a C₁-C₆-alkoxy, a C₁-C₆-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxy-C₂-C₆-alkenyl, a C₁-C₆-alkylsulfanyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulfanyl having 1

to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphiny, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphiny having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-alkylsulfonamide; and

- R⁷ is a halogen atom, a nitro group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkenyl, a C₁-C₈-alkylsulfanyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphiny, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphiny having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-alkylsulfonamide;

as well as its salts, N-oxydes, metallic and metalloidic complexes.

In the context of the present invention :

- halogen means fluorine, bromine, chlorine or iodine.
- carboxy means -C(=O)OH; carbonyl means -C(=O)-; carbamoyl means -C(=O)NH₂; N-hydroxycarbamoyl means -C(=O)NHOH;
- an alkyl group, an alkenyl group, and an alkynyl group as well as moieties containing these terms, can be linear or branched.

In the context of the present invention, it has also to be understood that in the case of di-substituted amino and of di-substituted carbamoyl radicals, the two substituents may form together with the nitrogen atom bearing them a saturated heterocyclic ring containing 3 to 7 atoms.

Any of the compound of the present invention can exist in one or more optical or chiral isomer forms depending on the number of asymmetric centres in the compound. The invention thus relates equally to all the optical isomers and to their racemic or scalemic mixtures (the term "scalemic" denotes a mixture of enantiomers

in different proportions), and to the mixtures of all the possible stereoisomers, in all proportions. The diastereoisomers and/or the optical isomers can be separated according to the methods which are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

5 Any of the compound of the present invention can also exist in one or more geometric isomer forms depending on the number of double bonds in the compound. The invention thus relates equally to all geometric isomers and to all possible mixtures, in all proportions. The geometric isomers can be separated according to general methods, which are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

10 Any of the compound of general formula (I) wherein R₁ represents a hydroxy or sulfanyl group, and/or X represents a hydroxy, sulfanyl or amino group, may be found in its tautomeric form resulting of the shift of the proton of said hydroxy, sulfanyl or amino group. Such tautomeric forms of such compounds are also part of the present invention. More generally speaking, all tautomeric forms of compounds
15 of general formula (I) wherein R₁ represents a hydroxy or sulfanyl group, and/or X represents a hydroxy, sulfanyl or amino group, as well as the tautomeric forms of the compounds which can optionally be used as intermediates in the preparation processes, and which will be defined in the description of these processes, are also part of the present invention.

20

According to the present invention, the 2-pyridyl is substituted in 6-position by R¹ and may be substituted in any other position by (X)_n, in which X and n are as defined above. Preferably, the present invention relates to N-[2-(2-pyridinyl)ethyl]benzamide derivative of general formula (I) in which the different
25 characteristics may be chosen alone or in combination as being :

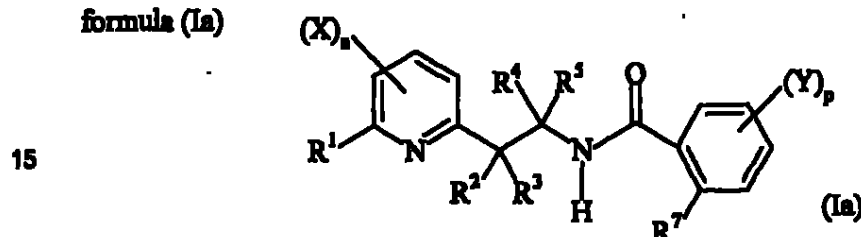
- as regards R¹, R¹ is a hydrogen atom or a halogen atom;
- as regards n, n is 1 or 2;
- as regards X, X is a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;
- as regards the positions in which the 2-pyridyl moiety is substituted by X, the 2-pyridyl moiety is substituted by X in 3- and/or in 5-position.

30

According to the present invention, the phenyl is substituted in ortho position by R⁷ and may be substituted in any other position by (Y)_p, in which Y and p are as defined above. Preferably, the present invention relates to N-[2-(2-pyridinyl)ethyl]benzamide derivative of general formula (I) in which the different
35 characteristics may be chosen alone or in combination as being :

- as regards R^7 , R^7 is a halogen atom, a C_1-C_6 -alkyl or a C_1-C_6 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;
- as regards p , p is 1 or 2. More preferably, p is 1.
- as regards Y , Y is a hydrogen atom, a halogen atom or a C_1-C_6 -alkyl. More preferably Y is a hydrogen atom;
- as regards the positions in which the phenyl moiety is substituted by Y , the phenyl moiety is substituted by Y preferentially first in para position.

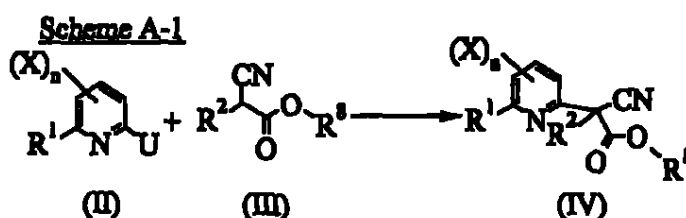
The present invention also relates to a process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a process (A) for the preparation of compound of general formula (Ia)



wherein :
 - R^1, R^2, R^7, X, Y, n and p are as defined above;
 - R^3 is a C_1-C_6 -alkyl;

which comprises

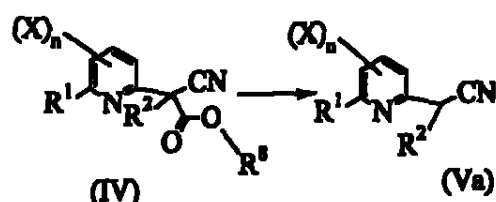
- a first step according to reaction scheme A-1 :



- in which :
- R^1, R^2, X and n are as defined above;
 - R^8 is a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;
 - U is a leaving group chosen as being a halogen, a C_1-C_6 alkylsulfonate or a C_1-C_6 haloalkylsulfonate;
- comprising the arylation of a cyanoacetate derivative of general formula (III) by a pyridine derivative of general formula (II), to provide a 2-(pyridyl)cyanoacetate derivative of general formula (IV), in the presence of a base, at a temperature of from 0°C to 200°C ;

- a second step according to reaction scheme A-2 :

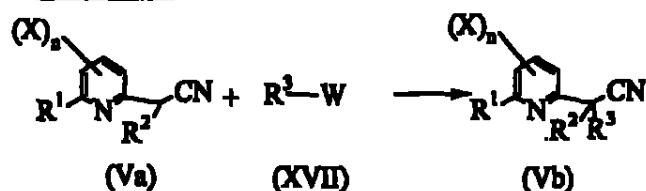
Scheme A-2



- 5 in which : - R^1 , R^2 , X , n are as defined above;
 - R^3 is a hydrogen atom;
 - R^6 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;
 comprising a basic hydrolysis, an acidic hydrolysis or a displacement by an halide of
 10 a compound of general formula (IV) in the same or a different pot to provide, upon heating at a temperature of from 40°C to reflux, a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Va);

- a third step according to reaction scheme A-3 :

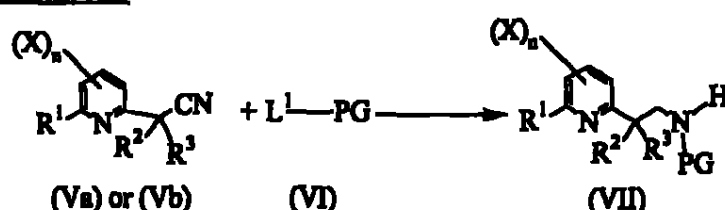
Scheme A-3



15

- in which : - R^1 , R^2 , X , n are as defined above;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl;
 - W is a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate, a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate,
 20 comprising the alkylation of a compound of general formula (Va) by a reagent of general formula (XVII) to provide a compound of general formula (Vb);
 - a fourth step according to reaction scheme A-4 :

Scheme A-4



in which : - R¹, R², X, n are as defined above;

- R³ is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl;

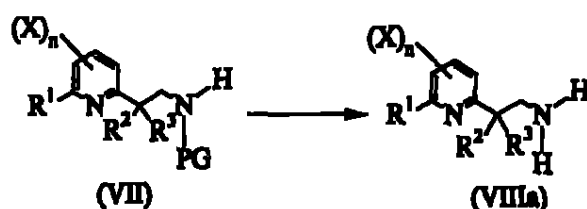
- L¹ is a leaving group chosen as being a -OR⁸ group or a -OCOR⁸ group, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a -COOR⁸ group or -COR⁸ group, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising the reduction, by hydrogenation or by an hydride donor, of a compound of general formula (Va) or (Vb), in the presence of a catalyst and in the presence of a compound of general formula (VI) to produce a compound of general formula (VII), at a temperature of from 0°C to 150°C and under a pressure of from 1 bar and 100 bar;

- a fifth step according to reaction scheme A-5 :

Scheme A-5



in which : - R¹, R², X, n are as defined above;

- R³ is a C₁-C₆ alkyl;

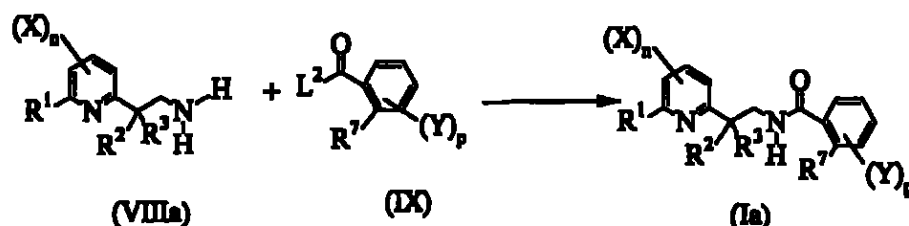
- PG represents a protecting group which may be a -COOR⁸ group or -COR⁸ group, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a deprotection reaction, in an acidic or in a basic medium, of a compound of general formula (VII) to provide an amine derivative of general formula (VIIIa) or

one of its salt;

- a sixth step according to reaction scheme A-6 :

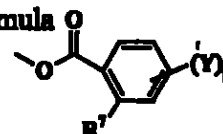
Scheme A-6



in which : - R¹, R², R⁷, X, Y, n and p are as defined above;

- R³ is a C₁-C₆ alkyl;

- L² is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, an OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIa) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

The first step (step A-1) of the process A according to the present invention is conducted in the presence of a base. Preferably, the base will be chosen as being an inorganic or an organic base. Suitable examples of such bases may for example be alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, carbonates or hydrogen carbonates, acetates or tertiary amines.

The first step (step A-1) of the process A according to the present invention is conducted at a temperature of from 0°C to 200°C. Preferably, first step (step A-1) is conducted at a temperature of from 0°C to 120°C, more preferably at a temperature of from 0°C to 80°C.

The first step (step A-1) of the process A according to the present invention may be conducted in the presence of a solvent. Preferably, the solvent is chosen as being water, an organic solvent or a mixture of both. Suitable organic solvents may for example be aliphatic, alicyclic or aromatic solvent.

The first step (step A-1) of the process A according to the present invention may also be conducted in the presence of a catalyst. Preferably, the catalyst is chosen as being palladium salts or complexes. More preferably, the catalyst is chosen as being a palladium complex. Suitable palladium complex catalyst may for example be generated directly in the reaction mixture by separately adding to the reaction

mixture a palladium salt and a complex ligand. Suitable ligands may for example be bulky phosphines or arsines ligands, such as (R)-(-)-1-[(S)-2-(dicyclohexylphosphino)ferrocenyl]ethylidicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; (R)-(-)-1[(S)-2-(dicyclohexylphosphino)ferrocenyl]ethylidiphenylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; (R)-(-)-1[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethylidit-butylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; or (R)-(-)-1[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethylidicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both.

The fourth step (step A-4) of the process A according to the present invention is conducted in the presence of a hydride donor. Preferably, the hydride donor is chosen as being metal or metalloïd hydrides such as LiAlH₄, NaBH₄, KBH₄, B₂H₆.

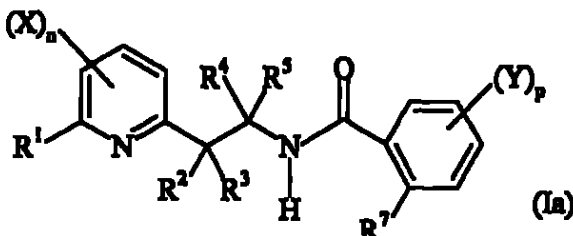
The fourth step (step A-4) of the process A according to the present invention is conducted in the presence of a catalyst. Preferably, the catalyst is chosen as being Co(II)-Chloride, Ni(II)-chloride, ammonia or one of its salt, Palladium on charcoal, Raney Nickel, Raney Cobalt or Platinum.

The fourth step (step A-4) of the process A according to the present invention is conducted at a temperature of from 0°C to 150°C. Preferably the temperature is of from 10°C to 120°C. More preferably, the temperature is of from 10°C to 80°C.

The fourth step (step A-4) of the process A according to the present invention is conducted under a pressure of from 1 bar to 100 bar. Preferably the pressure is of from 1 bar to 50 bar.

The fourth step (step A-4) of the process A according to the present invention may be conducted in the presence of an organic solvent, of water or of a mixture thereof. Preferably, the solvent is chosen as being ether, alcohol, carboxylic acid, or a mixture thereof with water or pure water.

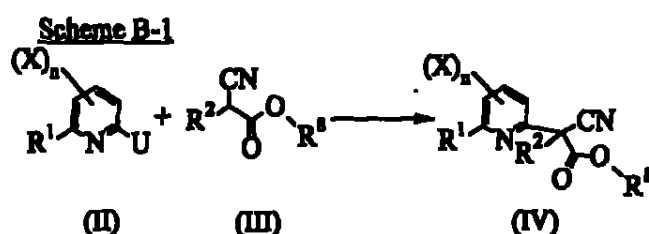
The present invention also relates to another process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a second process B for the preparation compound of general formula (Ia)



wherein :
 - R^1, R^2, R^7, X, Y, n and p are as defined above;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl;

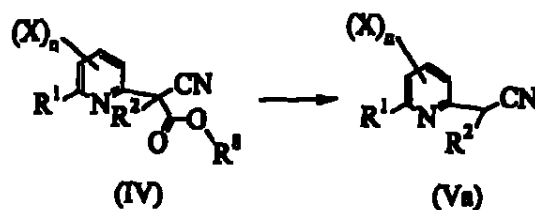
5 which comprises

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



- 10 in which :
 - R^1, R^2, X and n are as defined above;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;
 - U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;
- 15 comprising the arylation of a cyanoacetate derivative of general formula (III) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a 2-pyridylcyanoacetate derivative of general formula (IV);
- a second step according to reaction scheme B-2 :

Scheme B-2

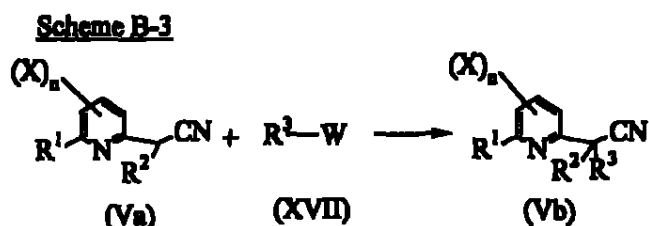


20

in which :
 - R^1, R^2, X and n are as defined above;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

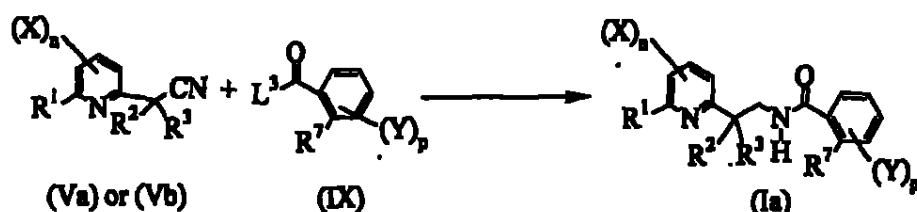
- 25 comprising a basic hydrolysis, an acidic hydrolysis or a displacement by an halide of a compound of general formula (IV) in the same or a different pot to provide, upon heating at a temperature of from 40°C to reflux, a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Va);

- a third step according to reaction scheme B-3 :

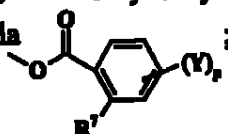


- 5 in which : - $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{X}, n$ are as defined above;
 - R^3 is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl;
 - W is a halogen atom, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkylsulfonate, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate,
 comprising the alkylation of a compound of general formula (Va) by a reagent of
 10 general formula (XVII) to provide a compound of general formula (Vb);
 - a fourth step according to reaction scheme B-4 :

Scheme B-4



- 15 in which : - $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{X}, \text{Y}, n$ and p are as defined above;
 - R^3 is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl;
 - L^3 is a leaving group chosen as being $-\text{OCOR}^a$, R^a being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; -
 20 OCHO , $-\text{SCSN}(\text{Me})_2$ or a group of formula



- comprising the reduction by hydrogenation or by an hydride of a compound of
 general formula (Va) or a compound of general formula (Vb) in the presence of a
 catalyst and in the presence of a compound of general formula (IX) to produce a
 25 compound of general formula (Ia), at a temperature of from 0°C to 150°C and under
 a pressure of from 1 bar and 100 bar.

Compound of general formula (Ia) according to the present invention may be prepared according to the process B.

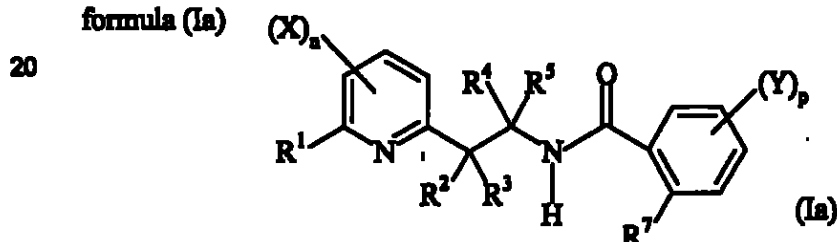
The preferred conditions under which step B-1 of the process B is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-1 of the above mentioned process A is conducted.

The preferred conditions under which step B-2 of the process B is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-2 of the above mentioned process A is conducted.

The preferred conditions under which step B-3 of the process B is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-3 of the above mentioned process A is conducted.

The preferred conditions under which step B-4 of the process B is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-4 of the above mentioned process A is conducted.

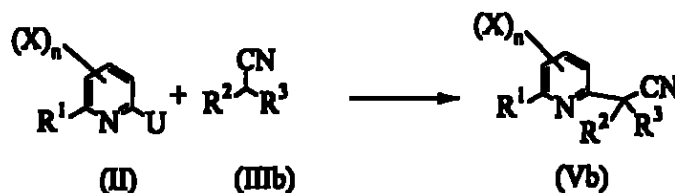
The present invention also relates to another process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a third process C for the preparation compound of general formula (Ia)



wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , X , Y , n and p are as defined above;
which comprises

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

Scheme C-1

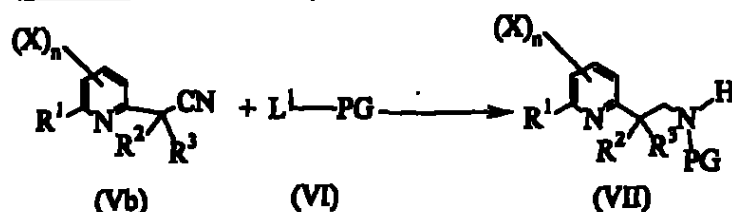


in which :
- R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined above;
- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a compound of general formula (IIIb) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Vb), in the presence of a base and at a temperature of from -100°C to 200°C;

- 5 - a second step according to reaction scheme C-2 :

Scheme C-2



in which : - R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined above;

- L^1 is a leaving group chosen as being a $-\text{OR}^8$ group or a $-\text{OCOR}^8$ group, R^8 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

10

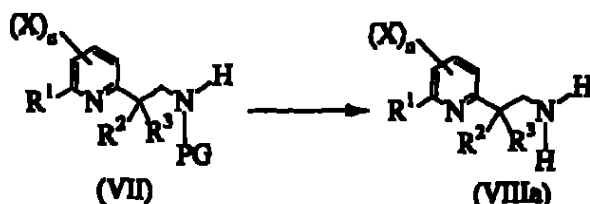
- PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^8$ group or $-\text{COR}^8$ group, R^8 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising the reduction, by hydrogenation or by an hydride donor, of a compound of general formula (Va) or (Vb), in the presence of a compound of general formula (VI) to produce a compound of general formula (VII) ;

15

- a third step according to reaction scheme C-3 :

Scheme C-3



20

in which : - R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined above;

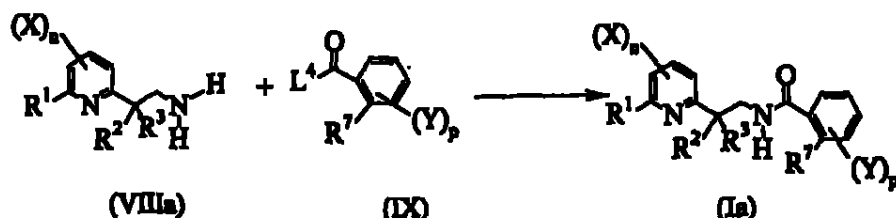
- PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^8$ group or $-\text{COR}^8$ group, R^8 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a deprotection reaction, in an acidic or in a basic medium, of a compound of general formula (VII) to provide an amine derivative of general formula (VIIIa) or one of its salt;

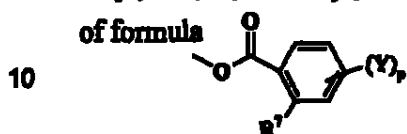
25

- a fourth step according to reaction scheme C-4 :

Scheme C-4



- 5 in which : - R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n and p are as defined above;
 - L⁴ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OCHO, -SCSN(Me)₂, an OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIa) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

16

The first step (step C-1) of the process C according to the present invention is conducted at a temperature of from -100°C to 200°C. Preferably, first step (step A-1) is conducted at a temperature of from -80°C to 120°C, more preferably at a temperature of from -80°C to 80°C.

20

The first step (step C-1) of the process C according to the present invention is conducted in the presence of a base. Preferably, the base will be chosen as being an inorganic or an organic base. Suitable examples of such bases may for example be alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, carbonates or hydrogen carbonates, acetates or tertiary amines.

25

The first step (step C-1) of the process C according to the present invention may be conducted in the presence of a solvent. Preferably, the solvent is chosen as being water, an organic solvent or a mixture of both. Suitable organic solvents may for example be aliphatic, alicyclic or aromatic solvent.

30

The first step (step C-1) of the process C according to the present invention may also be conducted in the presence of a catalyst. Preferably, the catalyst is chosen as being palladium salts or complexes. More preferably, the catalyst is chosen as being a palladium complex. Suitable palladium complex catalyst may for example be

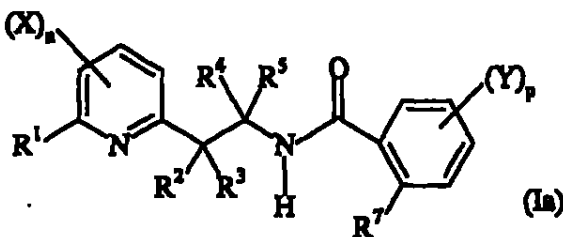
generated directly in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand. Suitable ligands may for example be bulky phosphines or arsines ligands, such as (R)-(-)-1-[(S)-2-(dicyclohexylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine and its
 5 corresponding enantiomer, or a mixture of both; (R)-(-)-1-[(S)-2-(dicyclohexylphosphino)ferrocenyl]ethyl-diphenylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-di-*t*-butylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; or (R)-(-)-1-[(S)-2-
 10 (diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both.

The preferred conditions under which step C-2 of the process C is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-4 of the above
 15 mentioned process A is conducted.

The preferred conditions under which step C-3 of the process C is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-5 of the above mentioned process A is conducted.

The preferred conditions under which step C-4 of the process C is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-6 of the above
 20 mentioned process A is conducted.

The present invention also relates to another process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present
 25 invention there is provided a fourth process D for the preparation of compound of general formula (Ia)

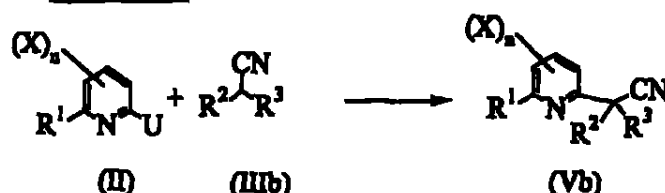


wherein :
 - R^1, R^2, R^7, X, Y, n and p are as defined above;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl;

which comprises

35 - a first step according to reaction scheme D-1 :

Scheme D-1



in which : - R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined above;

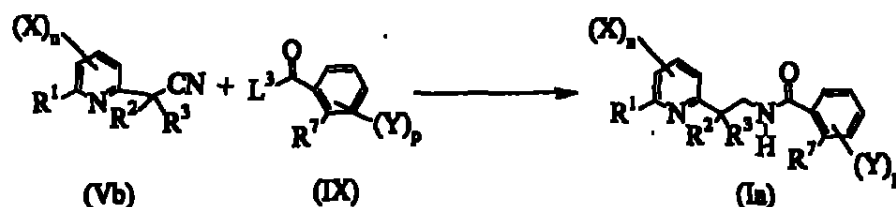
- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;

- 5 comprising the arylation of a compound of general formula (IIIb) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Vb), in the presence of a base and at a temperature of from -100°C to 200°C;

- a second step according to reaction scheme D-2 :

10

Scheme D-2



in which : - R^1 , R^2 , R^7 , X , Y , n and p are as defined above;

- R^3 is a C_1 - C_6 alkyl;

- L^3 is a leaving group chosen as being $-OCOR^8$, R^8 being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; -

OCHO, $-SCSN(Me)_2$ or a group of formula

The structure shows a benzamide derivative where the benzene ring has substituents R^7 and $(Y)_p$, and is connected to a carbonyl group which is further connected to an oxygen atom.

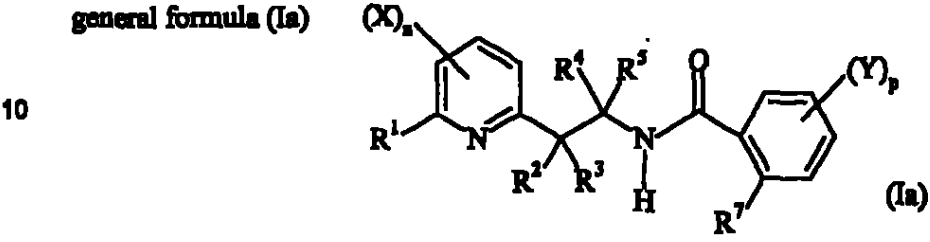
- comprising the reduction by hydrogenation or by an hydride donor a compound of general formula (Va) or a compound of general formula (Vb) in the presence of a compound of general formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

Compound of general formula (Ia) according to the present invention may be prepared according to the process D.

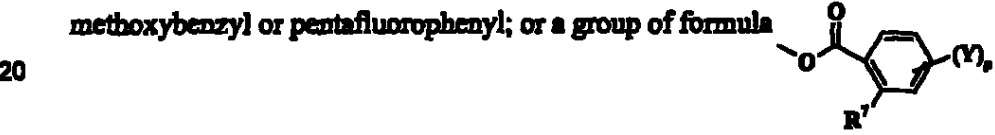
- 25 The preferred conditions under which step D-1 of the process D is conducted are the same than the preferred conditions under which step C-1 of the above mentioned process C is conducted.

The preferred conditions under which step D-2 of the process D is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-4 of the above mentioned process A is conducted.

5 The present invention also relates to a process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a fifth process (E) for the preparation of compound of general formula (Ia)



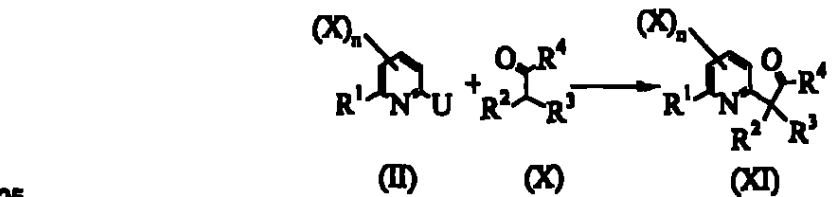
wherein :
- R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n and p are as defined above;
- R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;
- R⁵ is a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl; - L⁴ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OCHO, -SCSN(Me)₂, an OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



which comprises

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

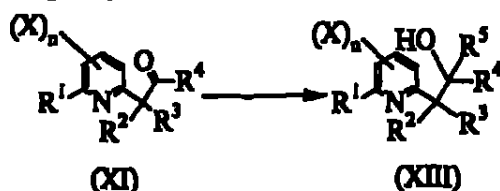
Scheme E-1



in which :
- R¹, R², R³, X and n are as defined above;
- R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;
- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate or a C₁-C₆ haloalkylsulfonate;

30 comprising the arylation of a compound of general formula (X) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a compound of general formula (XI);
- a second step according to reaction scheme E-2 :

Scheme E-2



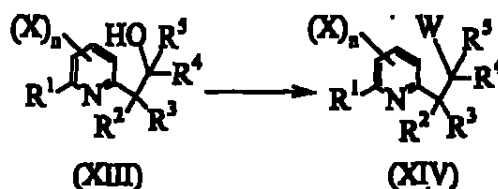
in which : - R^1, R^2, R^3, X and n are as defined above;

- R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

- 5 comprising the conversion of a compound of general formula (XI) into a compound of general formula (XIII) by addition of a compound of general formula R^5-M , in which R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl and M is a metal specie;

- a third step according to reaction scheme E-3 :

Scheme E-3



10 in which : - R^1, R^2, R^3, X and n are as defined above;

- R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

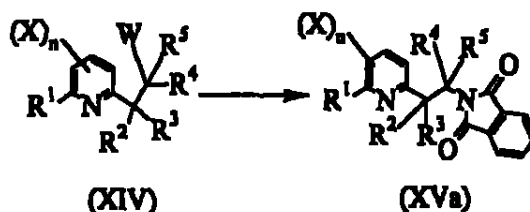
- R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

- 15 - W is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate;

comprising the activation of a compound of general formula (XIII) by converting it into a compound of general formula (XIV);

- a fourth step according to reaction scheme E-4 :

Scheme E-4

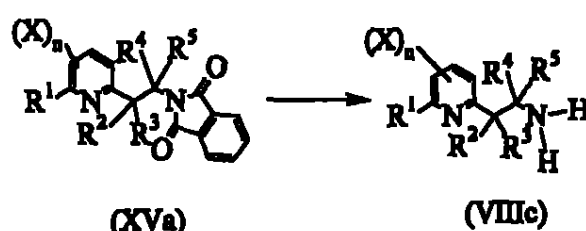


20 in which : - R^1, R^2, R^3, X and n are as defined above;

- R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

- R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

- W is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate;
comprising the substitution of a compound of general formula (XIV) by a phthalimide derivative or one of its salt to provide a compound of general formula (XVa);
- 5 - a fifth step according to reaction scheme E-5 :

Scheme E-5

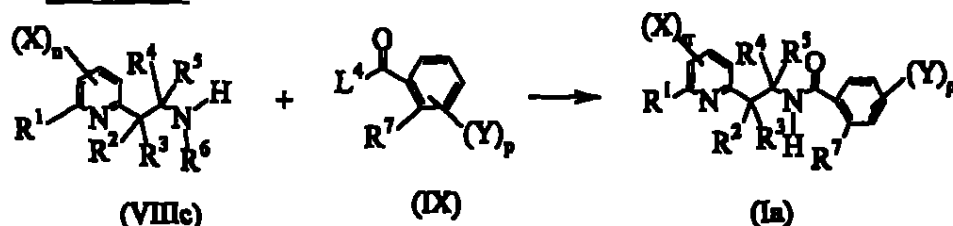
- in which :
- R¹, R², R³, X and n are as defined above;
 - R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;
 - R⁵ is a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;

10

comprising the de-protection of a compound of general formula (XVa) by reacting it with hydrazine hydrate or a hydrazine salt to provide an amine derivative of general formula (VIIIc) or one of its salt;

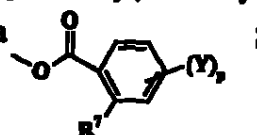
- a sixth step according to reaction scheme E-6 :

15

Scheme E-6

- in which :
- R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n and p are as defined above;
 - R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;
 - R⁵ is a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl; - L⁴ is a leaving

- 20 group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OCHO, -SCSN(Me)₂, an OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula

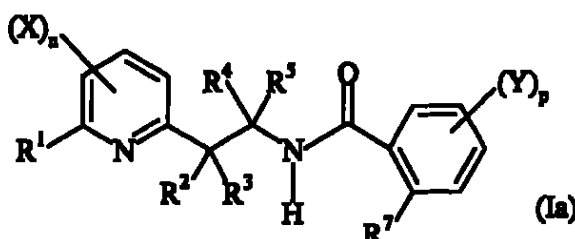


comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

Compound of general formula (I) according to the present invention may be prepared according to the process E.

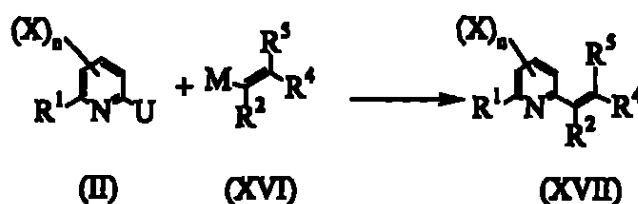
The preferred conditions under which step E-6 of the process E is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-6 of the above mentioned process A is conducted.

The present invention also relates to another process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a sixth process F for the preparation of compound of general formula (Ia)



wherein :
 - R^1 , R^7 , X , Y , n and p are as defined above;
 - R^2 , R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;
 which comprises
 - a first step according to reaction scheme F-1 :

Scheme F-1



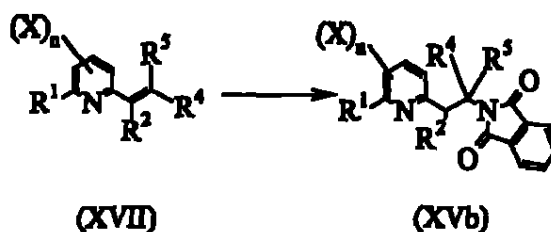
in which :
 - R^1 , X and n are as defined above;
 - U is a leaving group chosen as being a halogen atom a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;
 - R^2 , R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;
 - M is a metal or a metalloid specie;

comprising a coupling reaction of a pyridine derivative of general formula (II) with a vinylic specie of general formula (XVI), at a temperature of from 0°C to 200°C, to provide a compound of general formula (XVII);

- a second step according to reaction scheme F-2 :

5

Scheme F-2



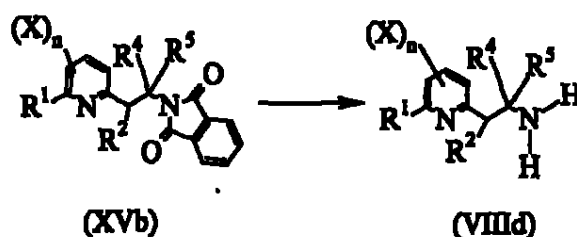
in which : - R¹, X and n are as defined above;

- R², R⁴ and R⁵ are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;

10 comprising the addition of a phthalimide or one of its salt on a compound of general formula (XVII) to provide a compound of general formula (XVb);

- a third step according to reaction scheme F-3 :

Scheme F-3



15 in which : - R¹, X and n are as defined above;

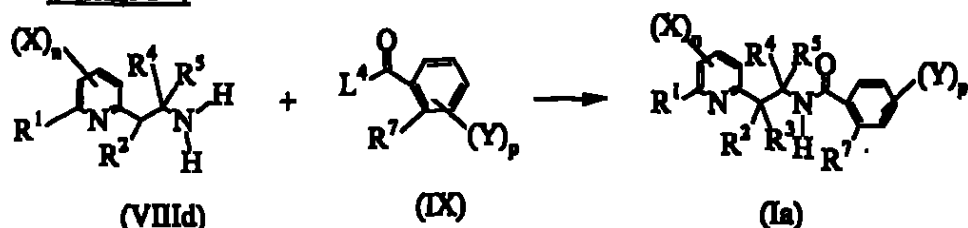
- R², R⁴ and R⁵ are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;

comprising the de-protection of a compound of general formula (XVb) with hydrazine hydrate or an hydrazine salt, to provide an amine derivative of general formula (VIIId) or one of its salts;

20

- a fourth step according to reaction scheme F-4 :

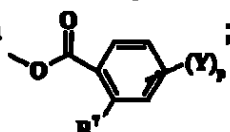
Scheme F-4



in which : - R¹, R⁷, X, Y, n and p are as defined above;

- R², R⁴ and R⁵ are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;

- L⁴ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OCHO, -SCSN(Me)₂, an OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

The first step (step F-1) of the process F according to the present invention is conducted in the presence of a vinylic specie of general formula (XVI) in which M can be a metal or a metalloid specie. Preferably M is a tin derivative or a boron derivative. More preferably M is a tri-*n*-butyltin group.

The first step (step F-1) of the process F according to the present invention is conducted at a temperature of from 0°C to 200°C. Preferably, step G-1 is conducted at a temperature of from 60°C to 160°C, more preferably at temperature of from 80°C to 140°C.

The first step (step F-1) of the process F according to the present invention may be conducted in the presence of a solvent. Preferably, the solvent is chosen as being water, an organic solvent or a mixture of both. Suitable organic solvents may for example be aliphatic, alicyclic or aromatic solvent.

The first step (step F-1) of the process F according to the present invention may also be conducted in the presence of a catalyst. Preferably, the catalyst is chosen as being palladium salts or complexes. More preferably, the catalyst is chosen as being a palladium complex. Suitable palladium complex catalyst may for example be generated directly in the reaction mixture by separately adding to the reaction

mixture a palladium salt and a complex ligand. Suitable ligands may for example be bulky phosphines or arsines ligands, such as (R)-(-)-1-[(S)-2-(dicyclohexylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; (R)-(-)-1-[(S)-2-(dicyclohexylphosphino)ferrocenyl]ethyldiphenylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both; or (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both.

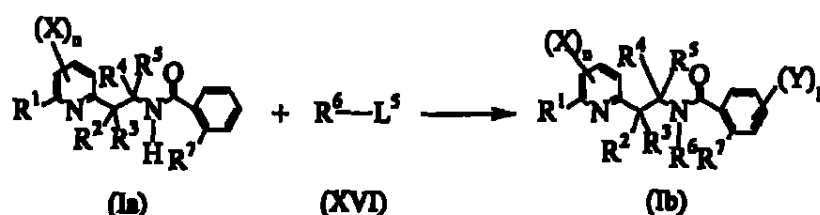
The first step (step F-1) of the process F according to the present invention may also be conducted in the presence of a base. Preferably, the base is chosen as being an inorganic or an organic base. Suitable examples of such bases may for example be alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcohates, carbonates or hydrogen carbonates, acetates or tertiary amines.

The preferred conditions under which step F-3 of the process F is conducted are the same than the preferred conditions under which step E-5 of the above mentioned process E is conducted.

The preferred conditions under which step F-4 of the process F is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-6 of the above mentioned process A is conducted.

Any of the above described processes A to F may optionally comprise a further step according to reaction scheme G :

Scheme G



in which : - $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, X, Y, n$ and p are as defined above;
 - L^3 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a 4-

methyl phenylsulfonyloxy, a methylsulfonyloxy;

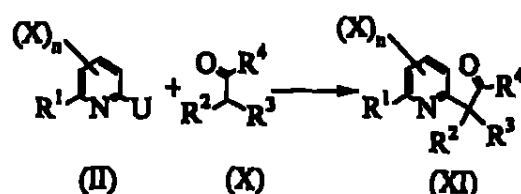
comprising the reaction of a compound of general formula (Ia) with a compound of general formula (XVI) to provide a compound of general formula (Ib).

The present invention also relates to another process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a seventh process H for the preparation of compound of

6 general formula (I) as defined above, which comprises

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

Scheme H-1



in which : - R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined above;

10 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;

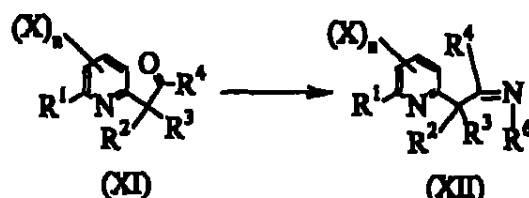
- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a compound of general formula (X) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a compound of general formula (XI), in the presence of a base, at a temperature of from 0°C to 200°C ;

15

- a second step according to reaction scheme H-2 :

Scheme H-2



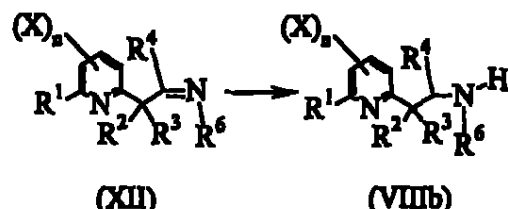
in which : - R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined above;

20 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;

- R^6 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a C_1 - C_6 alkoxy or a C_3 - C_7 cycloalkyl;

comprising the reaction of a compound of general formula (XI) with an amine of formula $\text{R}^6\text{-NH}_2$ to provide an imine derivative of general formula (XII);

25 - a third step according to scheme H-3 :

Scheme H-3

in which : - R^1, R^2, R^3, X and n are as defined above;

- R^4 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;

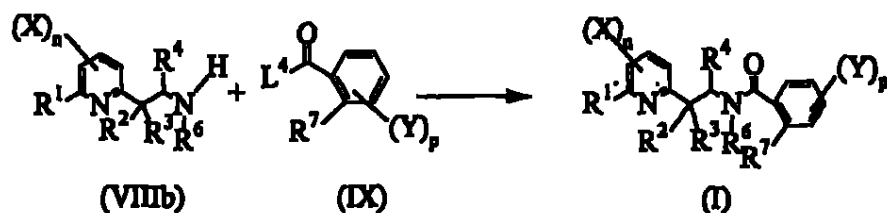
- R^6 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a C_1 -

5 C_6 alkoxy or a C_3 - C_7 cycloalkyl;

comprising the reduction of an imine derivative of general formula (XII) by hydrogenation or by an hydride donor, in the same or a different pot to provide an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt;

- a fourth step according to reaction scheme H-4 :

10

Scheme H-4

in which : - $R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ and p are as defined above;

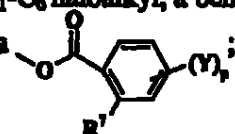
- R^4 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;

- R^6 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a C_1 -

15 C_6 alkoxy or a C_3 - C_7 cycloalkyl;

- L^4 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, an OR^8 group, an $OCOR^8$, R^8 being a C_1 - C_4 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula

20



comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (I).

25

Compound of general formula (I) according to the present invention may be prepared according to the process H.

The preferred conditions under which step H-1 of the process H is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-1 of the above mentioned process A is conducted.

The third step (step H-3) of the process H according to the present invention is conducted in the presence of a hydride donor. Preferably, the hydride donor is chosen as being metal or metalloid hydrides such as LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

The compound according to the present invention can be prepared according to the general processes of preparation described above. 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 this method according to the specifics of each of the compounds, which it is desired to synthesise.

The present invention also relates to a fungicidal composition comprising an effective amount of an active material of general formula (I). Thus, according to the present invention, there is provided a fungicidal composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of general formula (I) as defined above and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

In the present specification, the term "support" denotes a natural or synthetic, organic or inorganic material with which the active material is combined 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 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 material and/or the inert support are water-insoluble and when the vector agent for the application is water. Preferably, surfactant content may be comprised between 5% and 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 materials 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 material, preferably 10 to 70% by weight.

Compositions according to the present 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 of the invention can also be mixed with one or more insecticides, fungicides, bactericides, attractant acaricides or pheromones or other compounds with biological activity. The mixtures thus obtained have a broadened spectrum of activity. The mixtures with other fungicides are particularly advantageous.

The fungicidal compositions of the present invention can be used to curatively or preventively control the phytopathogenic fungi of crops. Thus, according to a further

aspect of the present invention, there is provided a method for curatively or preventively controlling the phytopathogenic fungi of crops characterised in that a fungicidal composition as hereinbefore defined is applied to the seed, the plant and/or to the fruit of the plant or to the soil in which the plant is growing or in which it is desired to grow.

6 The composition as used against phytopathogenic fungi of crops comprises an effective and non-phytotoxic amount of an active material of general 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
10 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 fungicidal 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.

15 The method of treatment according to the present invention is 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 present invention can also be useful to treat the overground parts of the plant such as trunks,
20 stems or stalks, leaves, flowers and fruits 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 fruits such as apples and pears, but also stone fruits such as apricots, almonds and peaches), *Ribesiodae* sp., *Juglandaceae* sp.,
25 *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (for instance banana trees and plantains), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (for instance lemons, oranges and grapefruits); leguminous crops such as *Solanaceae* sp. (for instance tomatoes), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (for instance lettuces), *Umbelliferae*
30 sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (for instance peas), *Rosaceae* sp. (for instance strawberries); big 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),
35 *Papilionaceae* sp. (for instance soja), *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 plants and the possible diseases of these plants protected by the method according to the present invention, mention may be made of :

- wheat, as regards controlling the following seed diseases: fusaria (*Microdochium nivale* and *Fusarium roseum*), stinking smut (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* or *Tilletia indica*), septoria disease (*Septoria nodorum*) and loose smut;
- wheat, as regards controlling the following diseases of the aerial parts of the plant: cereal eyespot (*Tapesia yellundae*, *Tapesia acutiformis*), take-all (*Gaeumannomyces graminis*), foot blight (*F. culmorum*, *F. graminearum*), black speck (*Rhizoctonia cerealis*), powdery mildew (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), rusts (*Puccinia striiformis* and *Puccinia recondita*) and septoria diseases (*Septoria tritici* and *Septoria nodorum*);
- wheat and barley, as regards controlling bacterial and viral diseases, for example barley yellow mosaic;
- barley, as regards controlling the following seed diseases: net blotch (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* and *Cochliobolus sativus*), loose smut (*Ustilago nuda*) and fusaria (*Microdochium nivale* and *Fusarium roseum*);
- barley, as regards controlling the following diseases of the aerial parts of the plant: cereal eyespot (*Tapesia yellundae*), net blotch (*Pyrenophora teres* and *Cochliobolus sativus*), powdery mildew (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), dwarf leaf rust (*Puccinia hordei*) and leaf blotch (*Rhynchosporium secalis*);
- potato, as regards controlling tuber diseases (in particular *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), mildew (*Phytophthora infestans*) and certain viruses (virus Y);
- potato, as regards controlling the following foliage diseases: early blight (*Alternaria solani*), mildew (*Phytophthora infestans*);
- cotton, as regards controlling the following diseases of young plants grown from seeds: damping-off and collar rot (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*) and black root rot (*Thielaviopsis basicola*);
- protein yielding crops, for example peas, as regards controlling the following seed diseases: anthracnose (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), fusaria (*Fusarium oxysporum*), grey mould (*Botrytis cinerea*) and mildew (*Peronospora pisi*);
- oil-bearing crops, for example rape, as regards controlling the following seed diseases: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* and *Sclerotinia sclerotiorum*;
- corn, as regards controlling seed diseases: (*Rhizopus* sp., *Penicillium* sp., *Trichoderma* sp., *Aspergillus* sp., and *Gibberella fujikuroi*);

- flax, as regards controlling the seed disease: *Alternaria linicola*;
- forest trees, as regards controlling damping-off (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*);
- rice, as regards controlling the following diseases of the aerial parts: blast disease (*Magnaporthe grisea*), bordered sheath spot (*Rhizoctonia solani*);
- leguminous crops, as regards controlling the following diseases of seeds or of young plants grown from seeds: damping-off and collar rot (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium sp.*);
- leguminous crops, as regards controlling the following diseases of the aerial parts: grey mould (*Botrytis sp.*), powdery mildews (in particular *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* and *Leveillula taurica*), fusaria (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), leaf spot (*Cladosporium sp.*), alternaria leaf spot (*Alternaria sp.*), anthracnose (*Colletotrichum sp.*), septoria leaf spot (*Septoria sp.*), black speck (*Rhizoctonia solani*), mildews (for example *Bremia lactucae*, *Peronospora sp.*, *Pseudoperonospora sp.*, *Phytophthora sp.*);
- fruit trees, as regards diseases of the aerial parts: monilia disease (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), scab (*Venturia inaequalis*), powdery mildew (*Podosphaera leucotricha*);
- vine, as regards diseases of the foliage: in particular grey mould (*Botrytis cinerea*), powdery mildew (*Uncinula necator*), black rot (*Guignardia biwelfi*) and mildew (*Plasmopara viticola*);
- beetroot, as regards the following diseases of the aerial parts: cercospora blight (*Cercospora beticola*), powdery mildew (*Erysiphe beticola*), leaf spot (*Ramularia beticola*).

25

The fungicide composition according to the present 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 of the present invention, or a composition according to the invention; this includes for example direct application, spraying, dipping, injection or any other suitable means.

35

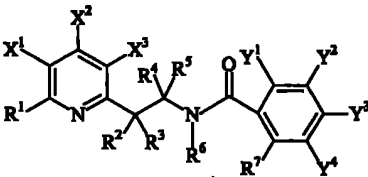
The dose of active material usually applied in the treatment according to the present invention is generally and advantageously between 10 and 800 g/ha, preferably

between 50 and 300 g/ha for applications in foliar treatment. The dose of active substance applied is generally and advantageously between 2 and 200 g per 100 kg of seed, preferably between 3 and 150 g per 100 kg of seed in the case of seed treatment. It is clearly understood that the doses indicated above are given as illustrative
 5 examples of the invention. A person skilled in the art will know how to adapt the application doses according to the nature of the crop to be treated.

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

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

The aspects of the present invention will now be illustrated with reference to the following tables of compounds and examples. The following Table illustrates in a
 25 non-limiting manner examples of fungicidal compounds according to the present invention. In the following Examples, M+1 (or M-1) means the molecular ion peak, plus or minus 1 a.m.u. (atomic mass units) respectively, as observed in mass spectroscopy and M (Apcl+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy.



Compound n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
1	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	363
2	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	329
3	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	-	309
4	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	374
5	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	421
6	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	329
7	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	F	H	H	327	-
8	CH ₃	H	Br	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	388
9	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	309
10	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	347

000043

W/O 2005/014545

34

PC/E/2004/09145

Compound n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
11	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	358
12	F	H	F	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	349
13	H	H	Cl	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	347
14	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	367
15	C(Me)=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	366
16	C(Me)=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	458
17	C(Me)=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	400
18	Br	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	387
19	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	374
20	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	329
21	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	405
22	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	455
23	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	397
24	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	387
25	CH=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	444
26	CH=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	386
27	CH=NOEt	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	458
28	CH=NOEt	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	400

008024

Compound n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
29	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	329
30	CH=NOiPr	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	414
31	CH=NOiPr	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	472
32	CH=NOiPr	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	424
33	CH=NOiPr	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	396
34	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	439
35	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	363
36	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	421
37	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	375
38	Cl	H	Br	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	407
39	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	339
40	Cl	H	Br	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	465
41	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	345
42	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	363
43	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	421
44	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	374
45	F	H	F	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	407
46	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	329

WO 2004/014345

35

PCT/EP2004/009145

0111143

Compound n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
47	F	H	F	F	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	359
48	F	H	F	F	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	315
49	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H	-	309
50	Br	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	406
51	Br	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	466
52	Br	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	419
53	Cl	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	376
54	Cl	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	434
55	Cl	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	386
56	H	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	343
57	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	381
58	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	391
59	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	347
60	Cl	H	Cl	H	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	377	-
61	Cl	H	Cl	H	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	435	-
62	Cl	H	F	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	365
63	Cl	H	F	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	423
64	F	H	F	F	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	331

000016

Compound n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
65	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	401
66	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	343
67	Cl	H	Cl	H	cPr		H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	389
68	Cl	H	H	H	cPr		H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	355
69	Cl	H	Cl	pCl-Ph-CH ₂ S	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	519
70	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	Cl	H	F	H	327	-

Examples of process for the preparation of the compound of general formula (I)**Example of process A : Preparation of N-[2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(iodo)benzamide (compound 5)****Step 1 : Preparation of *ter*-butyl cyano(3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetate**

To 50 ml of dimethoxyethane was slowly added portionwise at 0°C, 8.8 g (0.22 mol) of sodium hydride (60% dispersion in mineral oil).

To this suspension, was further added dropwise at 5°C, 17 g (0.12 mol) of *ter*-butyl cyanoacetate in 50 ml of dimethoxyethane. The suspension was stirred for 45 min at room temperature.

To the suspension were successively added 20 g (0.11 mol) of 2,3,5-trichloropyridine, 0.59 g (1.1 mmol) of (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-*ter*-butylphosphine, and 1.2g (2.2 mmol) of bis(dibenzylideneacetone)palladium(0).

The black mixture was heated at reflux for 5 hours. After cooling, the reaction mixture was poured into 100 ml of 1N hydrochloric acid. The aqueous phase was filtered on supersel and was extracted with ethyl acetate (3 x 200 ml). The organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 38.5 g of the crude product as a brown oil.

The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/chloroforme : 6/4) to give *ter*-butyl cyano(3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetate : 13 g (41%) as a yellow oil; mass spectrum: 287 (M+1).

Step 2 : Preparation of (3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetonitrile

To a solution of 12 g (0.042 mol) of *ter*-butyl cyano(3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetate in 50 ml of a 25/1 mixture of dimethylsulfoxide/water, was added 1.2 g (0.021 mol) of sodium chloride.

The mixture was stirred for 3 hours at 130°C. After cooling, the reaction mixture was poured into ice water. The aqueous phase was extracted with ethyl acetate (3 x 250 ml) and the organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 8.2 g of the crude product as a brown oil.

The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 7/3) to give (3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetonitrile: 5.9 g (76%) as an orange oil ; mass spectrum: 185 (M-1).

5 Step 3 : Preparation of *ter*-butyl 2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethylcarbamate

To a solution of 2.8 g (0.015 mol) of (3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetonitrile in 40 ml of methanol were rapidly added 3.9 g (0.0165 mol) of cobalt(II) chloride hexahydrate and 6.5 g (0.03 mol) of di-*ter*-butyl dicarbonate.

10 The dark solution was cooled to - 5°C and 3.96 g (0.1 mol) of sodium borohydride was added portion-wise at 0°C. The reaction mixture was stirred at room temperature for 18 hours.

The reaction mixture was neutralized by 1 N hydrochloric acid and methanol was remove under reduced pressure. The aqueous phase was reextracted by dichloromethane and the organic phase was washed with brine and dried over
15 magnesium sulphate. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 4 g of the crude product as a brown oil.

The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 5/1) to give *ter*-butyl 2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethylcarbamate: 2.0 g (46%) as a yellow oil ; mass spectrum: 192 (M+1-
20 101 (boc)).

Step 4 : Preparation of hydrochloride of 2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethanamine

To a solution of 2.4 g (8,2 mmol) of *ter*-butyl 2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl carbamate in 100 ml of dichloromethane were added 5 ml of
25 trifluoroacetic acid.

The mixture was stirred 1 hour at room temperature. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 4.7 g of a crude yellow oil.

The crude oil was redissolved in 10 ml of ethyl ether and 5.2 ml of 2 N
30 hydrochloric acid was added dropwise to precipitated the hydrochloride.

The solid was collected by filtration, washed by ethyl ether and dried under vacuum to give 2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl) ethanamine as its hydrochloride : 1.3 g (70%).

35 Step 5 : Preparation of N-[2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(*ortho*)benzamide (compound 5)

To a suspension of 60 mg (0.26 mmol) of the hydrochloride of 2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethanamine in 1 ml of dichloromethane was added successively 81 µl (0.58 mmol) of triethylamine and 85 mg (0.32 mmol) of 2-iodobenzoyl chloride. The mixture was stirred 18 hour at room temperature.

The reaction mixture was poured into water and the pH brought to 4. The aqueous phase was extracted with ethyl acetate and the organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate.

The solvent was evaporated and the residue was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 8/2) to give N-[2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(iodo)benzamide as a brown solid : 47 mg (43%); m.p. = 133°C.

The following compounds of formula (I) are prepared according to a process identical to the one used for the preparation of compound 5, and illustrate as well the present invention : 2, 3, 4, 13, 16, 17, 21, 22, 23, 25 and 26.

Example of process B : Preparation of N-[2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide (compound 1)

Step 1 : Preparation of methyl cyano(3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetate

To 100 ml of 1-methyl-2-pyrrolidinone was slowly added portionwise at 0°C, 24.8 g (0.62 mol) of sodium hydride (60% dispersion in mineral oil).

To this suspension, was further added dropwise at 5°C, 32.7 g (0.33 mol) of methyl cyanoacetate in 50 ml of 1-methyl-2-pyrrolidinone.

The suspension was stirred for 30 mn at 5°C. To the cooled suspension were then rapidly added 70 g (0.3 mol) of 2-bromo-3,5-dichloropyridine and the mixture was heated at 130°C for 5 hours. After cooling, the reaction mixture was poured into ice water. The aqueous phase was extracted with ethyl ether (3 x 300 ml) and the organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate.

The solvent was evaporated under reduced pressure and crude product was recrystallized in methanol to give methyl cyano(3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetate : 24.8 g (34%) as brown crystals; m.p. = 109-110°C.

Step 2 : Preparation of (3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetonitrile

To a solution of 14.45 g (0.06 mol) of methyl cyano(3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetate in 70 ml of a 25/1 mixture of dimethylsulfoxide/water, was added 1.75 g (0.03 mol) of sodium chloride.

5 The mixture was stirred for 4 hours at 130°C. After cooling, the reaction mixture was poured into ice water. The aqueous phase was extracted with ethyl ether (3 x 250 ml) and the organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 11.2 g of the crude product as a brown oil.

10 The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 7/3) to give (3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetonitrile: 8.65 g (77%) as a yellow oil ; mass spectrum: 185 (M-1).

15 Step 3 : Preparation of N-[2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide (compound 1)

To a solution of 1 g (5.4 mmol) of (3,5-dichloro-2-pyridinyl)acetonitrile in 15 ml of methanol were rapidly added 1.3 g (5.9 mmol) of cobalt(II) chloride hexahydrate and 3.9 g (10.8 mmol) of 2-trifluoromethylbenzoic anhydride.

20 The dark green solution was cooled to - 5°C and 1.4 g (37.4 mmol) of sodium borohydride was added portion-wise at 0°C.

The reaction mixture was stirred at room temperature for 18 hours. The reaction mixture was neutralized by 1N hydrochloric acid and methanol was removed under reduced pressure. The aqueous phase was reextracted by ethyl acetate and the organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 2.6 g of the crude product as a brown oil.

25 The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 7/3) to give N-[2-(3,5-dichloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl) benzamide: 0.80 g (41%) as white crystals; m.p. = 118°C.

30 The following compounds of formula (I) are prepared according to a process identical to the one used for the preparation of compound 1, and illustrate as well the present invention : 10, 11, 12 and 15.

Example of process C/D : Preparation of N-[2-(3-chloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide (compound 6)

Step 1 : Preparation of (3-chloro-2-pyridinyl)acetonitrile

5

To a solution of 55.5 ml (0.138 mol) of 2.5 M butyl lithium in 400 ml of anhydrous tetrahydrofurane at -78°C , were added 6.22 g (0.153 mol) of acetonitrile. The reaction mixture was stirred 45 mn at -78°C until formation of a suspension.

To the resulting suspension, a solution of 3 g (0.02 mol) of 2,3-dichloropyridine in 50 ml of anhydrous tetrahydrofurane was slowly added at -78°C and the reaction mixture was further stirred 2 hours at -78°C .

The reaction mixture was poured into 50 ml of water. The aqueous phase was extracted with dichloromethane and the organic phase was washed with water and dried over magnesium sulphate.

The solvent was evaporated under reduced pressure and the residue was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: dichloromethane) to give (3-chloro-2-pyridinyl)acetonitrile as an oil : 1,2 g (40%) ; mass spectrum: 153 (M+1).

Step 2 : Preparation of N-[2-(3-chloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide (compound 6)

20

To a solution of 0,152 g (1 mmol) of (3-chloro-2-pyridinyl)acetonitrile in 4 ml of methanol was successively added 0.238 g (1 mmol) of nickel(II) chloride hexahydrate, 0.724 g (2 mmol) of 2-trifluoromethylbenzoic anhydride and slowly added at 0°C , 0.265 g (7 mmol) of sodium borohydride.

25

The reaction mixture was stirred at room temperature for 18 hours. The solvent was evaporated and the residue was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 9/1) to give N-[2-(3-chloro-2-pyridinyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl) benzamide as an oil : 90 mg (27%) ; mass spectrum: 329 (M+1).

30

The following compounds of formula (I) are prepared according to a process identical to the one used for the preparation of compound 6, and illustrate as well the present invention : 7, 8 and 9.

35

Example of process G : Preparation of N-[2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethyl]-2-(iodo)benzamide (compound 14)

Step 1 : Preparation of 5-methyl-2-vinylpyridine

5

To a solution of 3 g (17.4 mmol) of 2-bromo-5-methylpyridine in 30 ml of dimethylformamide was successively added 2 g (1.7 mmol) of tetrakis (triphenylphosphine)palladium and 5.52 g (17.4 mmol) of tributyl(vinyl)tin. The reaction mixture was stirred at 120°C for 18 hours. After cooling, the reaction mixture was poured into 50 ml of water saturated with potassium fluoride and stirred for 1 hour.

The mixture was filtered on supracel and the aqueous phase was extracted with ethyl ether. The organic phase was washed twice with water saturated with potassium fluoride, once with water and dried over magnesium sulphate. The solvent was evaporated under reduced pressure to give 3.5 g of a crude mixture as a yellow oil.

The mixture was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 4/1) to give 5-methyl-2-vinylpyridine as a yellow oil : 0.9 g (43%) ; mass spectrum: 120 (M+1).

20

Step 2: Preparation of 2-[2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethyl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione

0.5 g (4.2 mmol) of 5-methyl-2-vinylpyridine and 0.618 g (4.2 mmol) of phthalimide was added to 0.5 ml of benzyltrimethylammonium hydroxide (Triton B™) and the mixture was heated at 200°C for 3 hours.

The mixture was allowed to cool to room temperature and was directly purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 5/1) to give 2-[2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethyl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione as white crystals : 0.680 g (59%) ; mass spectrum: 267 (M+1).

25

Step 3: Preparation of 2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethanamine

30

To a solution of 0.5 g (1.88 mmol) of 2-[2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethyl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione in 5 ml of methanol, was added 0.45 g (7.5 mmol) of hydrazine hydrate. The reaction mixture was reflux for 1 hour until completion.

The solvent was removed under vacuum and the residue was acidified with 1 N hydrochloric acid. The solid phthalhydrazide was removed by filtration. The

35

filtrate was basified with sodium hydroxyde and extracted by chloroform. The organic phase was washed with water and dried over magnesium sulphate.

The solvent was evaporated to give pure 2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethanamine as a yellow oil : 0.240 g (94%) ; mass spectrum: 137 (M+1).

5

Step 4: Preparation of N-[2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethyl]-2-(iodo)benzamide (compound 14)

To 0.06 mg (0.44 mmol) of 2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethanamine in solution
10 in 3 ml of acetonitrile, was successfully added 0.117 mg (0.44 mmol) of 2-iodobenzoyl chloride and 0.078 mg (0.44 mmol) of potassium carbonate.

The reaction mixture was stirred at room temperature for 18 hours. The reaction mixture was poured into aqueous potassium carbonate and the aqueous phase was extracted with ethyl acetate. The organic phase was washed with brine and dried
15 over magnesium sulphate.

The solvent was evaporated under reduced pressure to give pure N-[2-(5-methyl-2-pyridinyl)ethyl]-2-(iodo)benzamide as beige crystals : 0.08 g (53%) ; mass spectrum: 367 (M+1).

20

The compounds 18, 19, 20 and 24 are prepared according to a process identical to the one used for the preparation of compound 14, and illustrate as well the present invention.

Examples of biological activity of the compound of general formula (I)**Example A : *in vivo* test on *Alternaria brassicae* (Leaf spot of crucifers)**

5

The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/l. This suspension is then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

10 Radish plants (Pernot 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.

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

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

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

Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 330ppm with the following compounds: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 24, 25, 26, 27, 28, 30, 31, 32, 34, 35, 36, 37, 38, 40, 41, 43, 45, 47, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 67 and 68.

25

Example B : *in vivo* test on *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (powdery mildew of wheat)

30 The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/l. This suspension is then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

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

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

After 24 hours, the plants are contaminateded by dusting them with *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* spores, the dusting being carried out using diseased plants.

Grading is carried out 7 to 14 days after the contamination, in comparison with the control plants.

- 5 Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 330 ppm with the following compounds: 1, 3, 4, 5, 6, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 18, 38, 50, 43 and 45.

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

10

The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/L. This suspension is then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

- 15 Cucumber plants (Marketer variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 18- 20°C, are treated at the cotyledon Z11 stage by spraying with the aqueous suspension described above. Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

- 20 After 24 hours, the plants are contaminationed 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 :

- 25 - 20 g/L of gelatin
- 50 g/L of cane sugar
- 2 g/L of NH₄NO₃
- 1 g/L of KH₂PO₄

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

- 30 Grading is carried out 5/7 days after the contamination, in comparison with the control plants. Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 330 ppm with the following compounds: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 9, 10, 13, 18, 21, 22, 23, 25, 26, 27, 28, 29, 32, 34, 35, 38, 40, 43, 44, 45, 46, 47, 50, 51, 52, 53, 57 and 62.

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

The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/l. This suspension is then diluted
5 with water to obtain the desired active material concentration.

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

10 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.

15 Grading is carried out 12 days after the contamination, in comparison with the control plants. Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 330 ppm with the following compounds: 1, 2, 3, 4, 5, 9, 10, 11, 12, 13, 16, 18, 19, 21, 28, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 65, 67, and 68.

20

The N-{1-methylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]-ethyl}-4-phenylbenzamide disclosed by Patent Application WO 01/11965 (see compound 316 in Table D) showed poor effectiveness on *Alternaria brassicae*, and zero effectiveness on *Botrytis cinerea* at 330 ppm; the N-{1-ethylcarbamoyl-25 2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-3-nitrobenzamide also disclosed by Patent Application WO 01/11965 (see compound 307 in Table D) showed poor effectiveness on *Alternaria brassicae* and zero effectiveness on *Botrytis cinerea* at 330 ppm; the N-{1-ethylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]-ethyl}-benzamide and the N-{1-methylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-benzamide also disclosed by Patent Application WO 01/11965 (see compounds 304 and 314 in Table D) showed zero effectiveness on *Botrytis cinerea* at 330 ppm; and the N-{1-ethylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-4-chlorobenzamide, the N-{1-ethylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-2-bromobenzamide and the N-{1-methylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-4-methoxybenzamide also disclosed by Patent Application WO 01/11965 (see
35

WO 2005/014545

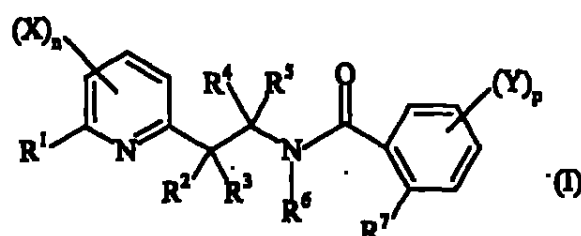
PCT/EP2004/009145

48

compounds 306, 310 and 315 in Table D) showed zero effectiveness on *Botrytis cinerea* at 330 ppm.

CLAIMS

1. A compound of general formula (I):



in which :

- n is 1, 2 or 3;

- X is the same or different and is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)- C_1 - C_6 -alkyl group, a C_1 - C_6 -alkyl, a C_2 - C_6 -alkenyl, a C_2 - C_6 -alkynyl, a C_1 - C_6 -alkylamino, a di- C_1 - C_6 -alkylamino, a C_1 - C_6 -alkoxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2 - C_6 -alkenyloxy, a C_2 - C_6 -halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3 - C_6 -alkynyloxy, a C_3 - C_6 -halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3 - C_6 -cycloalkyl, a C_3 - C_6 -halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylcarbamoyl, a di- C_1 - C_6 -alkylcarbamoyl, a (N- C_1 - C_6 -alkyl)oxycarbamoyl, a C_1 - C_6 -alkoxycarbamoyl, a (N- C_1 - C_6 -alkyl)- C_1 - C_6 -alkoxycarbamoyl, a C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylcarbonyloxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylcarbonylamino, a C_1 - C_6 -halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylaminocarbonyloxy, a di- C_1 - C_6 -alkylaminocarbonyloxy, a C_1 - C_6 -alkyloxycarbonyloxy, a C_1 - C_6 -alkylsulphenyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylsulphinyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylsulphonyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a (C1- C_6 -alkoxyimino)- C_1 - C_6 -alkyl, a (C1- C_6 -alkenyloxyimino)- C_1 - C_6 -alkyl, a (C1- C_6 -alkynyloxyimino)- C_1 - C_6 -alkyl, a

(benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl or a phenylamino;

- R¹ is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a
 5 formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₆-alkyl, a C₂-C₆-alkenyl, a C₂-C₆-alkynyl, a C₁-C₆-alkylamino, a di-C₁-C₆-alkylamino, a C₁-C₆-alkoxy, a C₁-C₆-halogenoalkoxy
 10 having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylsulfanyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenylloxy, a C₂-C₆-halogenoalkenylloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-alkynylloxy, a C₃-C₆-halogenoalkynylloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₃-C₆-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylcarbonyl, a C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₆-alkylcarbamoyl, a N-C₁-
 15 C₆-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₆-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₆-alkoxycarbonyl, a C₁-C₆-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylcarbonylamino, a C₁-C₆-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₆-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₆-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₆-alkylsulphenyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulphenyl
 20 having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylsulphanyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulphanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylsulphonyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenylloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynylloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a benzyloxy, a benzylsulfanyl optionally substituted
 25 with 1 to 5 halogen atoms, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl optionally substituted with 1 to 5 halogen atoms or a phenylamino;

with the proviso that X and R¹ are not both a hydrogen atom;

30 - R² and R³ are the same or different and are a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a hydroxy group, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenyl, a C₁-C₆-alkoxy, a C₁-C₆-alkylsulfanyl, a C₁-C₆-alkylsulphenyl, a C₁-C₆-alkylsulfinyl, a C₁-C₆-alkoxycarbonyl, a C₁-C₆-alkylcarbonyloxy or a C₁-C₆-alkylcarbonylamino;

35 or R² and R³ may together form a 3-, 4-, 5- or 6-membered carbocycle;

- R^4 and R^5 are the same or different and are a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_6 -alkyl or a C_1 - C_6 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

or R^4 and R^5 may together form a 3-, 4-, 5- or 6-membered carbocycle;

5 - R^6 is a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a hydroxy group, a C_1 - C_6 -alkyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkoxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3 - C_6 -cycloalkyl, a C_3 - C_6 -halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2 - C_6 -alkenyl, a C_2 - C_6 -alkynyl, a C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, a C_1 - C_6 -cyanoalkyl, a C_1 - C_6 -aminoalkyl, a C_1 - C_6 -alkylamino- C_1 - C_6 -alkyl, a di- C_1 - C_6 -alkylamino- C_1 - C_6 -alkyl, a C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, a C_1 - C_6 -halogenalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkyloxycarbonyl, a C_1 - C_6 -benzyloxycarbonyl, a C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, a C_1 - C_6 -alkylsulfonyl or a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulfonyl having 1 to 5 halogen atoms;

- p is 1, 2, 3 or 4;

15 - Y is the same or different and is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a C_1 - C_6 -alkyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2 - C_6 -alkenyl, a C_2 - C_6 -alkynyl, a C_1 - C_6 -alkylamino, a di- C_1 - C_6 -alkylamino, a C_1 - C_6 -alkoxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkoxy- C_2 - C_6 -alkenyl, a C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylcarbonyloxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylsulphenyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylsulphanyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulphanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylsulphonyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms or a C_1 - C_6 -alkylsulfonamide; and

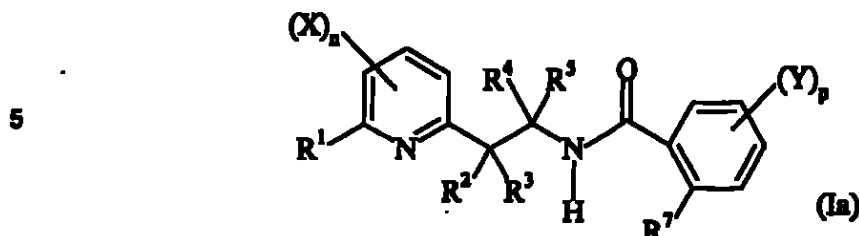
30 - R^7 is a halogen atom, a nitro group, a cyano group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a C_1 - C_6 -alkyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2 - C_6 -alkenyl, a C_2 - C_6 -alkynyl, a C_1 - C_6 -alkylamino, a di- C_1 - C_6 -alkylamino, a C_1 - C_6 -alkoxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkoxy- C_2 - C_6 -alkenyl, a C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_6 -alkylcarbonyloxy,

a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphanyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-alkylsulfonamide;

as well as its salts, N-oxides, metallic and metalloidic complexes.

2. A compound according to claim 1, characterised in that R¹ is a hydrogen atom or a halogen atom.
3. A compound according to claim 1 or 2, characterised in that n is 1 or 2.
4. A compound according to any of the claims 1 to 3, characterised in that X is a halogen atom or a C₁-C₈-alkyl.
5. A compound according to any of the claims 1 to 4, characterised in that the 2-pyridyl is substituted by X in 3- and/or in 5-position.
6. A compound according to any of the claims 1 to 5, characterised in that R² is a halogen atom, a C₁-C₈-alkyl or a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.
7. A compound according to any of the claims 1 to 6, characterised in that p is 1 or 2.
8. A compound according to claim 7, characterised in that p is 1.
9. A compound according to any of the claims 1 to 8, characterised in that Y is a hydrogen atom, a halogen atom or a C₁-C₈-alkyl.
10. A compound according to claim 9, characterised in that Y is a hydrogen atom.
11. A compound according to any of the claims 1 to 10, characterised in that the phenyl is substituted by Y preferentially first in para position.

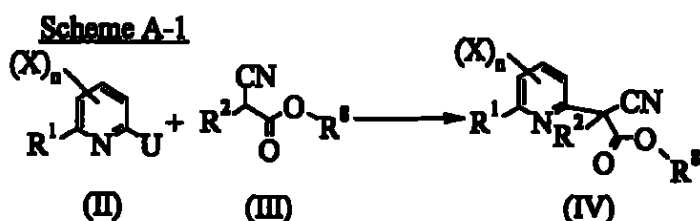
12. A process (A) for the preparation of compound of general formula (Ia)



wherein : - R^1, R^2, R^7, X, Y, n and p are as defined in claim 1 claim 1;
 - R^3 is a C_1-C_6 alkyl;

which comprises

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



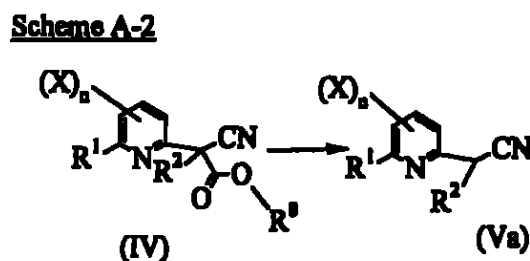
in which : - R^1, R^2, X and n are as defined in claim 1 claim 1;

- R^8 is a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- U is a leaving group chosen as being a halogen, a C_1-C_6 alkylsulfonate or a C_1-C_6 haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a cyanoacetate derivative of general formula (III) by a pyridine derivative of general formula (II), to provide a 2-(pyridyl)cyanoacetate derivative of general formula (IV), in the presence of a base, at a temperature of from 0°C to 200°C ;

- a second step according to reaction scheme A-2 :



in which : - R^1, R^2, X, n are as defined in claim 1 claim 1;

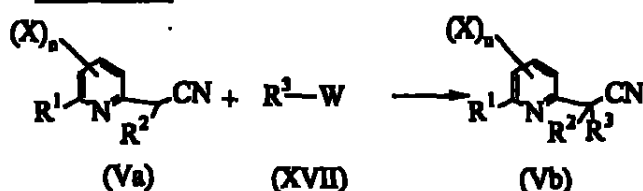
- R^3 is a hydrogen atom;

- R^8 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a basic hydrolysis, an acidic hydrolysis or a displacement by an halide of
 5 a compound of general formula (IV) in the same or a different pot to provide, upon heating at a temperature of from 40°C to reflux, a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Va);

- a third step according to reaction scheme A-3 :

Scheme A-3



10

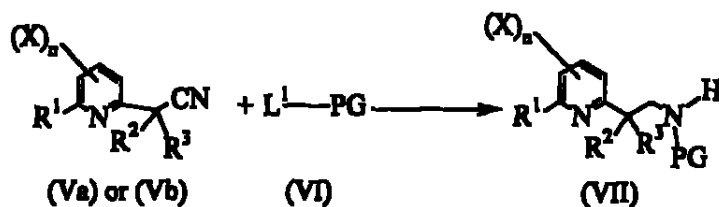
in which : - R^1 , R^2 , X , n are as defined in claim 1 claim 1;

- R^3 is a C_1 - C_6 alkyl;

- W is a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate, a C_1 - C_6
 15 haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate,
 comprising the alkylation of a compound of general formula (Va) by a reagent of general formula (XVII) to provide a compound of general formula (Vb);

- a fourth step according to reaction scheme A-4 :

Scheme A-4



20

in which : - R^1 , R^2 , X , n are as defined in claim 1 claim 1;

- R^3 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl;

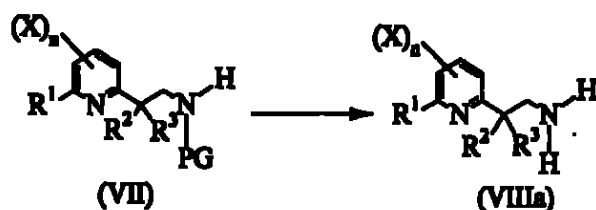
- L^1 is a leaving group chosen as being a $-OR^8$ group or a $-OCOR^8$ group, R^8 being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^8$ group or $-\text{COR}^8$ group, R^8 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising the reduction, by hydrogenation or by an hydride donor, of a compound of general formula (Va) or (Vb), in the presence of a catalyst and in the presence of a compound of general formula (VI) to produce a compound of general formula (VII), at a temperature of from 0°C to 150°C and under a pressure of from 1 bar and 100 bar;

- a fifth step according to reaction scheme A-5 :

Scheme A-5



in which : - $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{X}, n$ are as defined claim 1 claim 1;

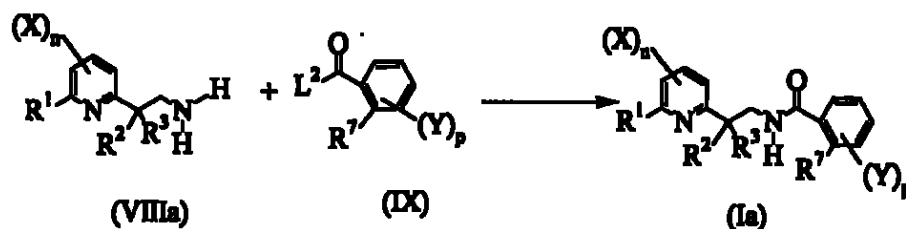
- R^3 is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^8$ group or $-\text{COR}^8$ group, R^8 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a deprotection reaction, in an acidic or in a basic medium, of a compound of general formula (VII) to provide an amine derivative of general formula (VIIIa) or one of its salt;

- a sixth step according to reaction scheme A-6 :

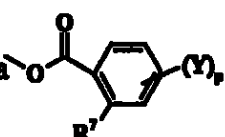
Scheme A-6



in which : - $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^7, \text{X}, \text{Y}, n$ and p are as defined in claim 1 claim 1;

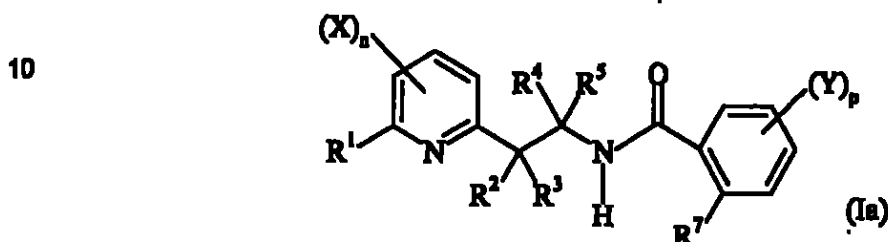
- R^3 is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl;

- L^2 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, an OR^8 group, an OCOR^8 , R^8 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl,

a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula ,

comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIa) or
 5 one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a
 compound of general formula (Ia).

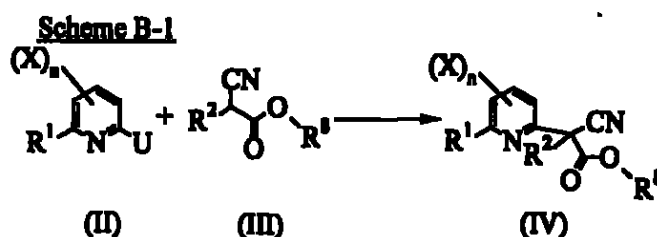
13. A process (B) for the preparation of compound of general formula (Ia)



15 wherein : - R¹, R², R⁷, X, Y, n and p are as defined in claim 1;
 - R³ is a C₁-C₆ alkyl;

which comprises

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



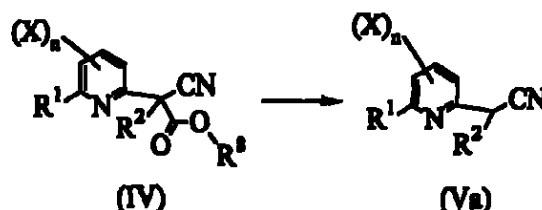
in which : - R¹, R², X and n are as defined in claim 1;

- R⁸ is a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

25 - U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate or a C₁-C₆ haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a cyanoacetate derivative of general formula (III) by a
 pyridine derivative of general formula (II) to provide a 2-pyridylcyanoacetate
 derivative of general formula (IV);

30 - a second step according to reaction scheme B-2 :

Scheme B-2

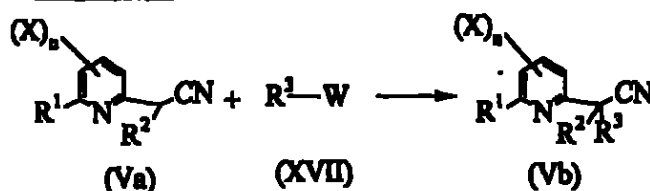
in which : - R^1, R^2, X and n are as defined in claim 1;

- R^8 is a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-

5 methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a basic hydrolysis, an acidic hydrolysis or a displacement by an halide of a compound of general formula (IV) in the same or a different pot to provide, upon heating at a temperature of from 40°C to reflux, a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Va);

10 - a third step according to reaction scheme B-3 :

Scheme B-3

in which : - R^1, R^2, X, n are as defined in claim 1;

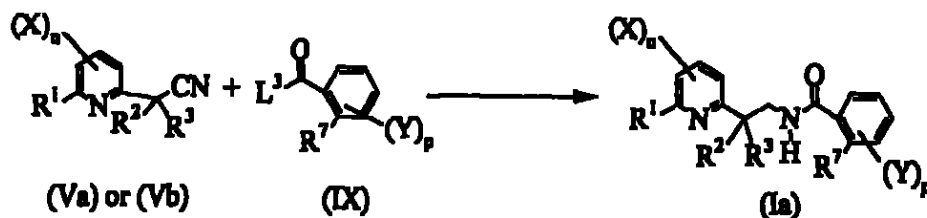
- R^3 is a C_1-C_6 alkyl;

15 - W is a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate,

comprising the alkylation of a compound of general formula (Va) by a reagent of general formula (XVII) to provide a compound of general formula (Vb);

- a fourth step according to reaction scheme B-4 :

20

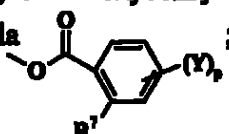
Scheme B-4

in which : - R^1, R^2, R^3, X, Y, n and p are as defined in claim 1;

- R^3 is a C_1 - C_4 alkyl;

- L^3 is a leaving group chosen as being $-OCOR^8$, R^8 being a C_1 - C_4 alkyl, a C_1 - C_4 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; - OCHO, $-SCSN(Me)_2$ or a group of formula

5

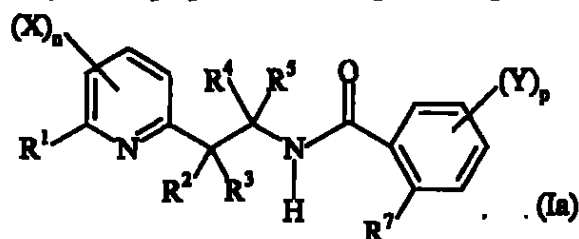


comprising the reduction by hydrogenation or by an hydride of a compound of general formula (Va) or a compound of general formula (Vb) in the presence of a catalyst and in the presence of a compound of general formula (IX) to produce a compound of general formula (Ia), at a temperature of from 0°C to 150°C and under a pressure of from 1 bar and 100 bar.

10

14. A process (C) for the preparation of compound of general formula (Ia)

15



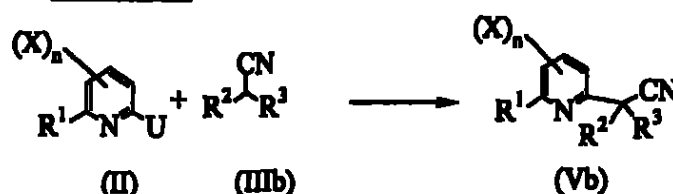
20

wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , X, Y, n and p are as defined in claim 1;

which comprises

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

Scheme C-1



25

in which : - R^1 , R^2 , R^3 , X and n are as defined in claim 1;

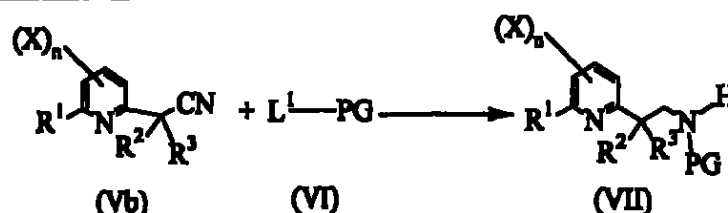
- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a compound of general formula (IIIb) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Vb), in the presence of a base and at a temperature of from -100°C to 200°C ;

30

- a second step according to reaction scheme C-2 :

Scheme C-2



in which : - R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;

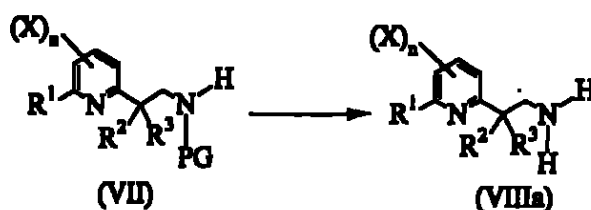
- L^1 is a leaving group chosen as being a $-OR^8$ group or a $-OCOR^8$ group, R^8 being a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-COOR^8$ group or $-COR^8$ group, R^8 being a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising the reduction, by hydrogenation or by an hydride donor, of a compound of general formula (Va) or (Vb), in the presence of a compound of general formula (VI) to produce a compound of general formula (VII);

- a third step according to reaction scheme C-3 :

Scheme C-3



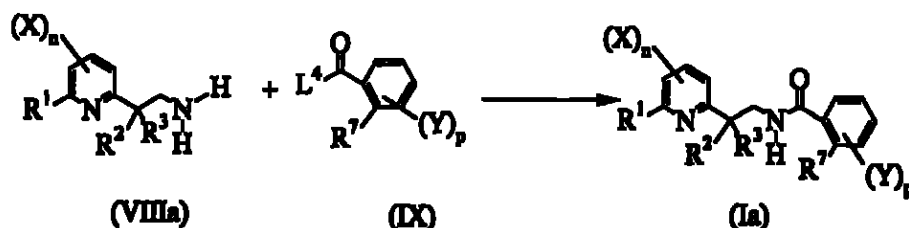
in which : - R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;

- PG represents a protecting group which may be a $-COOR^8$ group or $-COR^8$ group, R^8 being a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a deprotection reaction, in an acidic or in a basic medium, of a compound of general formula (VII) to provide an amine derivative of general formula (VIIIa) or one of its salt;

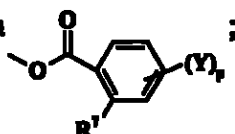
- a fourth step according to reaction scheme C-4 :

Scheme C-4



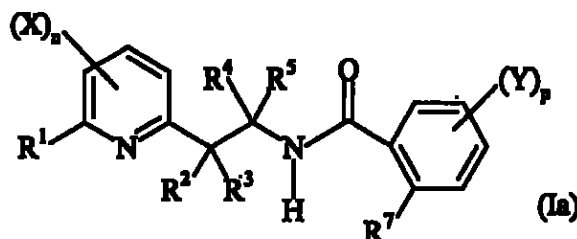
in which : - R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n and p are as defined in claim 1;

- L⁴ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OCHO, -SCSN(Me)₂, an OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



- comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIa) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

15. A process (D) for the preparation of compound of general formula (Ia)

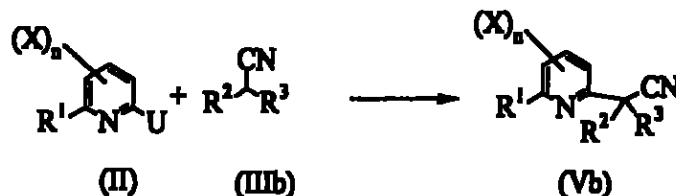


wherein : - R¹, R², R⁷, X, Y, n and p are as defined in claim 1;
- R³ is a C₁-C₆ alkyl;

which comprises

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

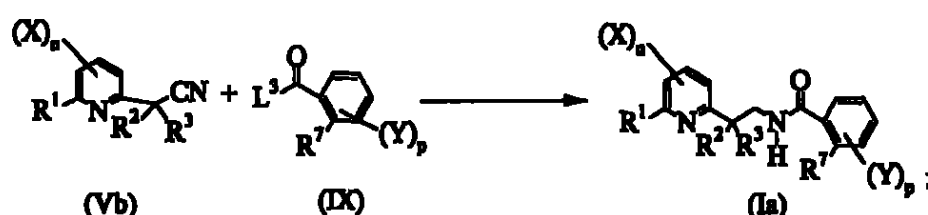
Scheme D-1



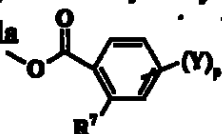
in which : - R¹, R², R³, X and n are as defined in claim 1;

- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate or a C₁-C₆ haloalkylsulfonate;
 comprising the arylation of a compound of general formula (IIIb) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (Vb), in the presence of a base and at a temperature of from -100°C to 200°C;
 - a second step according to reaction scheme D-2 :

Scheme D-2

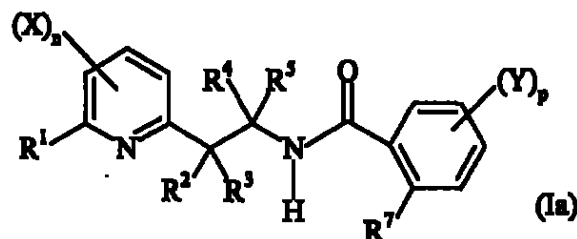


- in which : - R¹, R², R⁷, X, Y, n and p are as defined in claim 1;
 - R³ is a C₁-C₆ alkyl;
 - L³ is a leaving group chosen as being -OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; -OCHO, -SCSN(Me)₂ or a group of formula



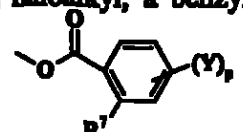
comprising the reduction by hydrogenation or by an hydride donor a compound of general formula (Va) or a compound of general formula (Vb) in the presence of a compound of general formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

16. A process (E) for the preparation of compound of general formula (Ia)



- wherein : - R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n and p are as defined in claim 1;
 - R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;
 - R⁵ is a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl; - L⁴ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OCHO, -SCSN(Me)₂, an

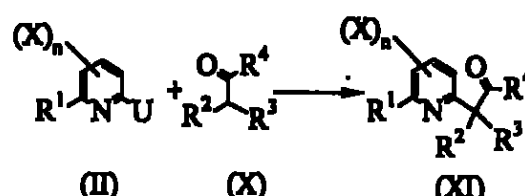
OR⁸ group, an OCOR⁸, R⁸ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



which comprises

- 5 - a first step according to reaction scheme E-1 :

Scheme E-1



in which : - R¹, R², R³, X and n are as defined in claim 1;

- R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;

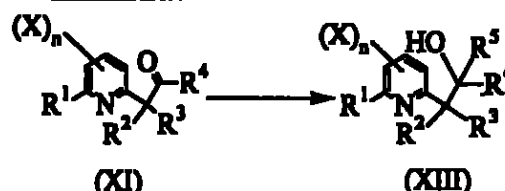
- 10 - U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate or a C₁-C₆ haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a compound of general formula (X) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a compound of general formula (XI);

- a second step according to reaction scheme E-2 :

15

Scheme E-2



in which : - R¹, R², R³, X and n are as defined in claim 1;

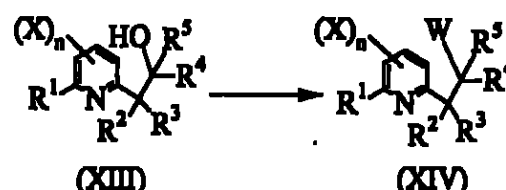
- R⁴ is a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl;

comprising the conversion of a compound of general formula (XI) into a compound of general formula (XIII) by addition of a compound of general formula R⁵-M, in which R⁵ is a C₁-C₆ alkyl or a C₁-C₆ haloalkyl and M is a metal specie;

20

- a third step according to reaction scheme E-3 :

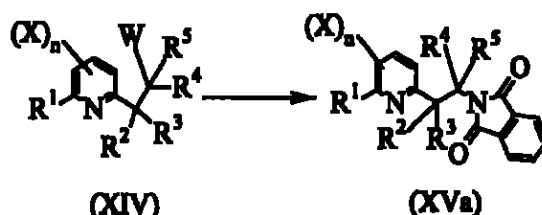
Scheme E-3



- in which :
- R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;
 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - W is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1-C_6

- alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate;
 comprising the activation of a compound of general formula (XIII) by converting it into a compound of general formula (XIV);
 - a fourth step according to reaction scheme E-4 :

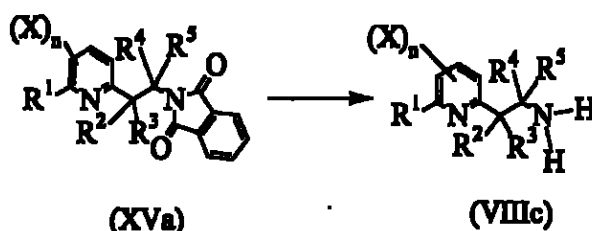
Scheme E-4



- in which :
- R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;
 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - W is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1-C_6

- alkylsulfonate, a C_1-C_6 haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate;
 comprising the substitution of a compound of general formula (XIV) by a phthalimide derivative or one of its salt to provide a compound of general formula (XVa);
 - a fifth step according to reaction scheme E-5 :

Scheme E-5

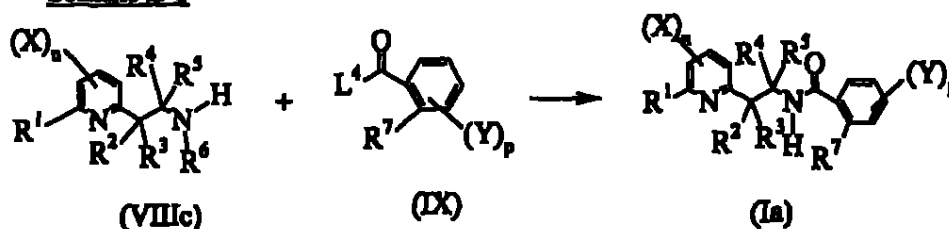


- in which :
- R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;
 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

- comprising the de-protection of a compound of general formula (XVa) by reacting it with hydrazine hydrate or a hydrazine salt to provide an amine derivative of general formula (VIIIc) or one of its salt;

- a sixth step according to reaction scheme E-6 :

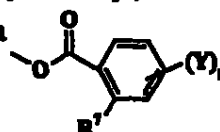
Scheme E-6



in which : - $R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ and p are as defined in claim 1;

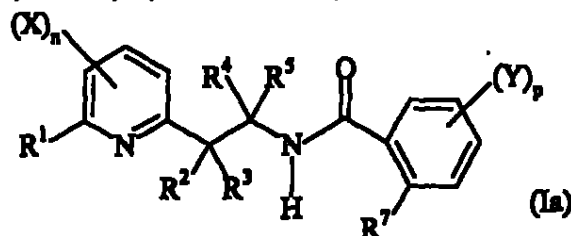
- R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

- R^5 is a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl; - L^4 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, an OR^8 group, an $OCOR^8$, R^8 being a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).

17. A process (F) for the preparation of compound of general formula (Ia)

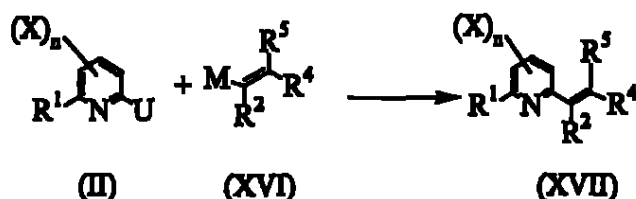


wherein : - R^1, R^7, X, Y, n and p are as defined in claim 1;

- R^2, R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;

which comprises

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

Scheme F-1

in which : - R^1 , X and n are as defined in claim 1;

- U is a leaving group chosen as being a halogen atom a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;

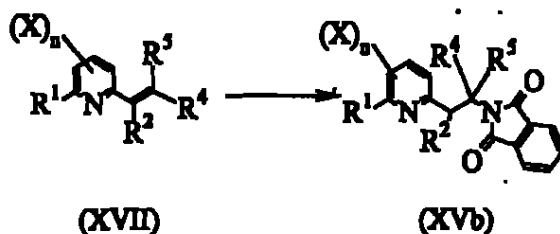
5 - R^2 , R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;

- M is a metal or a metalloid specie;

comprising a coupling reaction of a pyridine derivative of general formula (II) with a vinylic specie of general formula (XVI), at a temperature of from 0°C to 200°C , to

10 provide a compound of general formula (XVII);

- a second step according to reaction scheme F-2 :

Scheme F-2

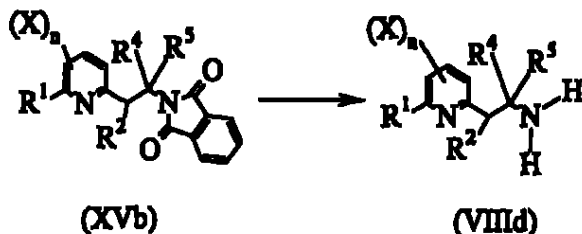
in which : - R^1 , X and n are as defined in claim 1;

15 - R^2 , R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;

comprising the addition of a phthalimide or one of its salt on a compound of general formula (XVII) to provide a compound of general formula (XVb);

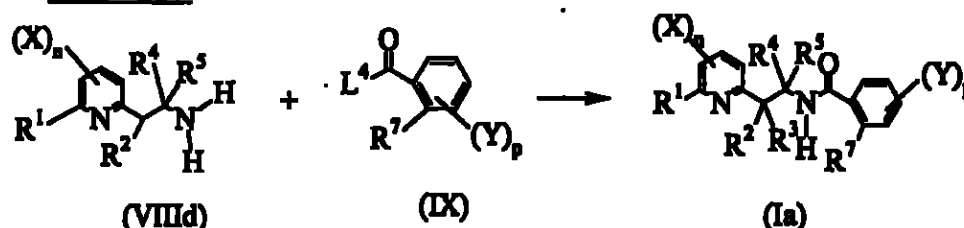
- a third step according to reaction scheme F-3 :

20

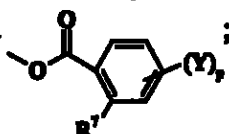
Scheme F-3

- in which :
- R^1 , X and n are as defined in claim 1;
 - R^2 , R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;
- comprising the de-protection of a compound of general formula (XVb) with hydrazine hydrate or an hydrazine salt, to provide an amine derivative of general formula (VIIId) or one of its salts;
- 5 a fourth step according to reaction scheme F-4 :

Scheme F-4



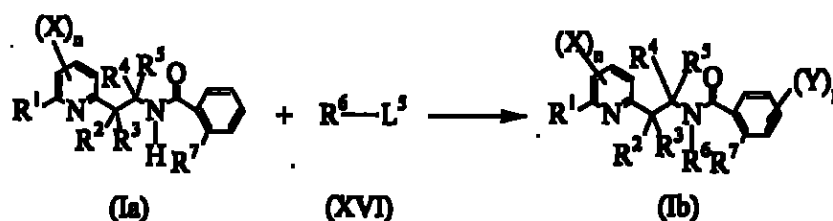
- 10 in which :
- R^1 , R^7 , X , Y , n and p are as defined in claim 1;
 - R^2 , R^4 and R^5 are independently from each other chosen as being a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl or a C_1 - C_6 haloalkyl;
 - L^4 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, an OR^8 group, an $OCOR^8$, R^8 being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula



- comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (Ia).
- 20

18. A process according to any of the claims 12 to 17 which further comprises a step according to reaction scheme G :
- 25

Scheme G



- in which :
- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , X , Y , n and p are as defined in claim 1;

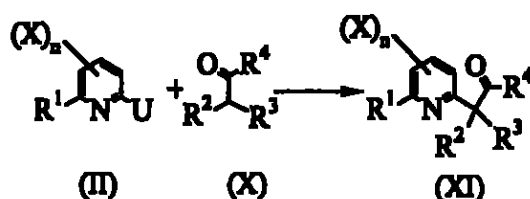
- L^5 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a 4-methyl phenylsulfonyloxy, a methylsulfonyloxy;
comprising the reaction of a compound of general formula (Ia) with a compound of general formula (XVI) to provide a compound of general formula (Ib).

5

19. A process for the preparation of compound of general formula (I) as defined in claim 1, which comprises

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

Scheme H-1



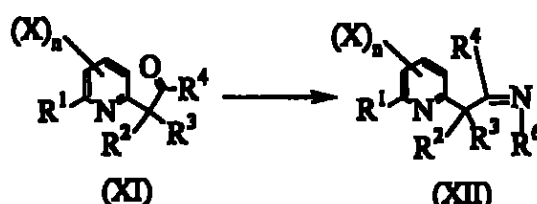
10

in which :
- R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;
- R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
- U is a leaving group chosen as being a halogen atom, a C_1-C_6 alkylsulfonate or a C_1-C_6 haloalkylsulfonate;

15 comprising the arylation of a compound of general formula (X) by a pyridine derivative of general formula (II) to provide a compound of general formula (XI), in the presence of a base, at a temperature of from 0°C to 200°C ;

- a second step according to reaction scheme H-2 :

Scheme H-2

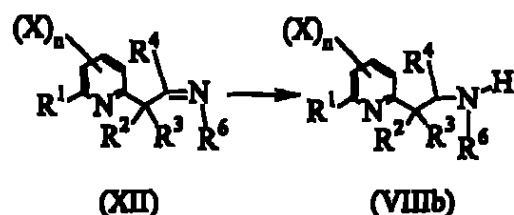


20

in which :
- R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;
- R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
- R^6 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a C_1-C_6 alkoxy or a C_3-C_7 cycloalkyl;

25 comprising the reaction of a compound of general formula (XI) with an amine of formula R^6-NH_2 to provide an imine derivative of general formula (XII);

- a third step according to scheme H-3 :

Scheme H-3

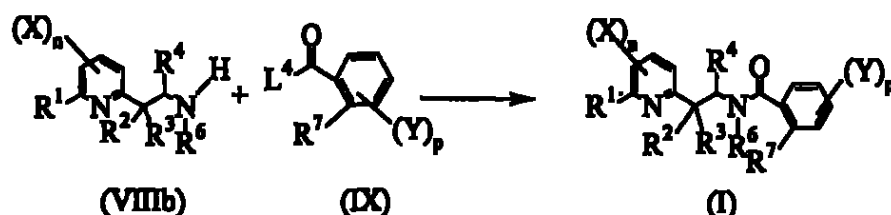
- in which :
- R^1, R^2, R^3, X and n are as defined in claim 1;
 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - R^6 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a C_1-

5 C_6 alkoxy or a C_3-C_7 cycloalkyl;

comprising the reduction of an imine derivative of general formula (XII) by hydrogenation or by an hydride donor, in the same or a different pot to provide an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt;

- a fourth step according to reaction scheme H-4 :

10

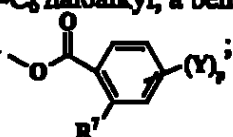
Scheme H-4

- in which :
- $R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ and p are as defined in claim 1;
 - R^4 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl or a C_1-C_6 haloalkyl;
 - R^6 is a hydrogen atom, a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a C_1-

15 C_6 alkoxy or a C_3-C_7 cycloalkyl;

- L^4 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, an OR^8 group, an $OCOR^8$, R^8 being a C_1-C_6 alkyl, a C_1-C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl; or a group of formula

20



comprising a coupling reaction of an amine derivative of general formula (VIIIb) or one of its salt, with a carboxylic acid derivative of formula (IX) to provide a compound of general formula (I).

25

20. Fungicidal composition comprising an effective amount of a compound

according to claim 1 and an agriculturally acceptable support.

21. *Method for preventively or curatively combating the phytopathogenic fungi of crops, characterised in that an effective and non-phytotoxic amount of a composition according to claim 20 is applied to the plant seeds or to the plant leaves and/or to the fruits of the plants or to the soil in which the plants are growing or in which it is desired to grow them.*
- 5

000089

40

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP2004/009145

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D213/61 C07D213/40 A01N43/40 C07D213/70

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 284 174 A (ICI PHARMA ; ICI PLC (GB)) 28 September 1988 (1988-09-28) * page 76; the compounds of formula A * * page 37; the starting material for example 77 *	1-5, 7-11
Y	WO 01/11965 A (AVENTIS CROPS SCIENCE GMBH ; BRIEGGS GEOFFREY GOWER (FR); STEELE CHRIS) 22 February 2001 (2001-02-22) cited in the application * the whole document; in particular, page 35, example 5 *	1-21
Y	WO 99/42447 A (MOLONEY BRIAN ANTHONY ; SAVILLE STONES ELIZABETH ANNE (GB); AGREVO) 26 August 1999 (1999-08-26) the whole document	1-21
-/-		

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document not published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

7 February 2005

Date of mailing of the international search report

11/02/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. 6818 Patentblatt 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-8040, Tx. 31 651 apo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fink, D

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/009145

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 3 996 044 A (KABBE ET AL) 30 November 1976 (1976-11-30) column 1, line 39 - column 2, line 6 column 27; claim 1 column 11, line 66 - column 12, line 27	1-21
A	US 4 006 239 A (MAYER ET AL) 1 February 1977 (1977-02-01) column 1, line 39 - column 2, line 20 column 23 - column 25; claim 1 column 13, line 57 - column 14, line 20	1-21
P,X	EP 1 389 614 A (BAYER CROPSCIENCE S.A) 18 February 2004 (2004-02-18) pages 12-15; claims 1-5,7,10-15	1-21

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP2004/009145

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0284174 A	28-09-1988	AU 606112 B2	31-01-1991
		AU 8317587 A	21-07-1988
		OE 3873127 D1	03-09-1992
		DE 3873127 T2	03-12-1992
		DK 22888 A	20-07-1988
		EP 0284174 A1	28-09-1988
		FI 880195 A	20-07-1988
		IE 873503 L	19-07-1988
		IL 84944 A	16-02-1992
		JP 63253069 A	20-10-1988
		NO 880182 A	20-07-1988
		NZ 223194 A	26-03-1991
		PT 86573 A .B	01-02-1988
		US 5173496 A	22-12-1992
		ZA 8800046 A	19-07-1988
WO 0111965 A	22-02-2001	AT 270817 T	15-07-2004
		AU 7278500 A	13-03-2001
		BR 0013371 A	07-05-2002
		CN 1370047 T	18-09-2002
		DE 60012188 D1	19-08-2004
		WO 0111965 A1	22-02-2001
		EP 1204323 A1	15-05-2002
		ES 2220533 T3	16-12-2004
		JP 2003506465 T	18-02-2003
		MX PA02001453 A	28-01-2003
		US 6821992 B1	23-11-2004
WO 9942447 A	26-08-1999	AU 751032 B2	08-08-2002
		AU 2527199 A	06-09-1999
		BR 9908007 A	30-01-2001
		CA 2319005 A1	26-08-1999
		CN 1132816 C	31-12-2003
		CZ 20002993 A3	14-11-2001
		EP 1056723 A1	06-12-2000
		WO 9942447 A1	26-08-1999
		HU 0100817 A2	30-07-2001
		ID 26626 A	25-01-2001
		JP 2002503723 T	05-02-2002
		NO 20004159 A	17-10-2000
		NZ 505954 A	20-12-2002
		PL 342376 A1	04-06-2001
		RU 2224746 C2	27-02-2004
		SI 20356 A	30-04-2001
		SK 12392000 A3	12-03-2001
		TR 200002395 T2	21-11-2000
		TR 200101071 T2	21-06-2002
		TW 575562 B	11-02-2004
		US 2003171410 A1	11-09-2003
		US 6503933 B1	07-01-2003
		ZA 9901292 A	13-09-1999
US 3995044 A	30-11-1976	DE 2428673 A1	02-01-1976
		AT 344172 B	10-07-1978
		AT 451075 A	15-11-1977
		BE 830211 A1	15-12-1975
		DK 268075 A	15-12-1975
		ES 438532 A1	01-02-1977

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/009145

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 3995044	A		FR 2274294 A1	09-01-1976
			GB 1465255 A	23-02-1977
			IE 41091 B1	10-10-1979
			JP 51008262 A	23-01-1976
			LU 72723 A1	13-04-1976
			NL 7507100 A	16-12-1975
US 4006239	A	01-02-1977	DE 2417763 A1	30-10-1975
			AT 346326 B	10-11-1978
			AT 267775 A	15-03-1978
			BE 827777 A1	10-10-1975
			CH 612683 A5	15-08-1979
			DK 154675 A	12-10-1975
			ES 436542 A1	01-01-1977
			FR 2267100 A1	07-11-1975
			JP 50137972 A	01-11-1975
			JP 50142738 A	17-11-1975
			LU 72252 A1	17-03-1976
			NL 7504234 A	14-10-1975
EP 1389614	A	18-02-2004	EP 1389614 A1	18-02-2004
			WO 2004016088 A2	26-02-2004

Nuevos compuestos 2-piridiniletilbenzamida

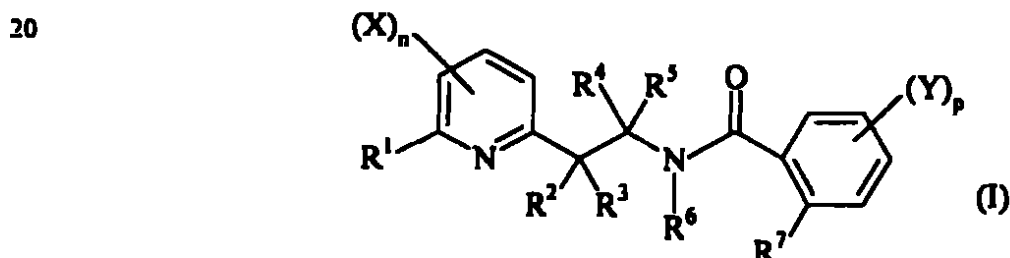
La presente invención se refiere a nuevos derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]benzamida, su procedimiento de preparación, su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas, y métodos para el control de hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones.

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

Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura, el uso de compuestos plaguicidas con objeto de evitar o luchar contra el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos usados por el agricultor. Es también de gran interés el uso de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con el objeto de reducir las cantidades de material activo que va a usar el agricultor, mientras que al mismo tiempo se mantiene una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos.

Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen las características anteriormente mencionadas.

De acuerdo con esto, la presente invención se refiere a derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]benzamida de fórmula general (I):



25 en la que

- n es 1, 2 ó 3;

- X es igual o diferente y es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un grupo alquilo(C₁-C₈), un grupo alquenilo(C₂-C₈), un grupo alquinilo(C₂-C₈), un grupo alquil(C₁-C₈)amino, un grupo di-alquil(C₁-C₈)amino, un grupo alcoxi(C₁-C₈), un grupo halogenoalcoxi(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil(C₂-C₈)oxi, un

30

35

halogenoalquenil(C₂-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquini(C₃-C₈)oxi, un halogenoalquini(C₃-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo(C₃-C₈), un halogenocicloalquilo(C₃-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un di-alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un (N-alquil(C₁-C₈))oxicarbamoilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo, un (N-alquil(C₁-C₈))-alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilamino, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilamino de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un di-alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un alquil(C₁-C₈)oxicarboniloxi, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfínilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfínilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi(C₁-C₈))-iminoalquilo(C₁-C₈), un (alquenil(C₁-C₈))-oxiiminoalquilo(C₁-C₈), un (alquini(C₁-C₈))oxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un (benciloxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

- R¹ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiiimino)-alquilo(C₁-C₈), un alquilo(C₁-C₈), un alquenilo(C₂-C₈), un alquini(C₃-C₈), un alquil(C₁-C₈)amino, un di-alquil(C₁-C₈)amino, un alcoxi(C₁-C₈), un halogenoalcoxi(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil(C₂-C₈)oxi, un halogenoalquenil(C₂-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquini(C₃-C₈)oxi, un halogenoalquini(C₃-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo(C₃-C₈), un halogenocicloalquilo(C₃-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un di-alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un N-alquil(C₁-C₈)oxicarbamoilo, un alcoxycarbamoilo(C₁-C₈), un N-alquil(C₁-C₈)-alcoxycarbamoilo(C₁-C₈), un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilamino, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilamino de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un di-alquil(C₁-

- C_8)aminocarboniloxi, un alquil(C_1-C_8)oxicarboniloxi, un alquil(C_1-C_8)sulfenilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)sulfinilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)sulfonilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un
 5 (alcoxi(C_1-C_8)-imino)-alquilo(C_1-C_8), un (alquenil(C_1-C_8)oxiimino)-alquilo(C_1-C_8), un (alquinil(C_1-C_8)oxiimino)-alquilo(C_1-C_8), un (benciloxiimino)-alquilo(C_1-C_8), un benciloxi, un bencilsulfanilo opcionalmente sustituido con 1 a 5 átomos de halógeno, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo opcionalmente sustituido con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilamino;
- 10 con la condición que X y R^1 no sean ambos un átomo de hidrógeno;
- R^2 y R^3 son iguales o diferentes y son un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo(C_2-C_8), un alcoxi(C_1-C_8), un alquil(C_1-C_8)sulfanilo, un alquil(C_1-C_8)sulfenilo, un alquil(C_1-C_8)sulfinilo, un alcoxi(C_1-C_8)carbonilo, un alquil(C_1-C_8)carboniloxi o un alquil(C_1-C_8)carbonilamino;
- 15 o R^2 y R^3 pueden formar juntos un carbociclo de 3, 4, 5 ó 6 miembros;
- R^4 y R^5 son iguales o diferentes y son un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo(C_1-C_8) o un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno;
- 20 o R^4 y R^5 pueden formar juntos un carbociclo de 3, 4, 5 ó 6 miembros;
- R^6 es un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C_1-C_8), un halogenoalcoxi(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo(C_3-C_8), un halogenocicloalquilo(C_3-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo(C_2-C_8), un alquinilo(C_2-C_8), un alcoxi(C_1-C_8)-alquilo(C_1-C_8), un cianoalquilo(C_1-C_8), un aminoalquilo(C_1-C_8), un alquil(C_1-C_8)amino-alquilo(C_1-C_8), un di-alquil(C_1-C_8)amino-alquilo(C_1-C_8), un alquil(C_1-C_8)carbonilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)oxicarbonilo, un benciloxicarbonilo, un alcoxi(C_1-C_8)-alquil(C_1-C_8)carbonilo, un alquil(C_1-C_8)sulfonilo o
- 25 un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno;
- 30 - p es 1,2,3 ó 4;
- Y es igual o diferente y es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo
- 35 formilamino, un grupo carboxi, un alquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5

átomos de halógeno, un alquenilo(C₂-C₈), un alquinilo(C₂-C₈), un alquil(C₁-C₈)amino, un di-alquil(C₁-C₈)amino, un alcoxi(C₁-C₈), un halogenoalcoxi(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C₁-C₈)-alquenilo(C₂-C₈), un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfinilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno o una alquil(C₁-C₈)sulfonamida; y

- R⁷ es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁸-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un alquilo(C₁-C₈), un halogenoalquilo(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo(C₂-C₈), un alquinilo(C₂-C₈), un alquil(C₁-C₈)amino, un di-alquil(C₁-C₈)amino, un alcoxi(C₁-C₈), un halogenoalcoxi(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C₁-C₈)-alquenilo(C₂-C₈), un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfinilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno o una alquil(C₁-C₈)sulfonamida;

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

en el contexto de la presente invención

- halógeno significa flúor, bromo, cloro o iodo.

- carboxi significa -C(=O)OH ; carbonilo significa -C(=O)-; carbamoilo significa -C(=O)NH₂ ; N-hidroxycarbamoilo significa -C(=O)NHOH ;

- un grupo alquilo, un grupo alquenilo y un grupo alquinilo, así como restos que contienen estos términos, que pueden ser lineales o ramificados.

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

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede 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 sus mezclas racémicas o escalémicas (el término escalémico
5 denota una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones), y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Pueden separarse los diaestereoisómeros y/o los isómeros ópticos de acuerdo con los métodos que son conocidos *per se* por el hombre ordinario experto en la técnica.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede también existir
10 en una o más formas de isómeros geométricos, dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las posibles mezclas, en todas las proporciones. Pueden separarse los isómeros geométricos de acuerdo con métodos generales, que son conocidos *per se* por el hombre ordinario experto en la técnica.

15 Cualquiera de los compuestos de fórmula general (I), en la que R_1 representa un grupo hidroxilo o sulfanilo, y/o X representa un grupo hidroxilo, sulfanilo o amino, puede encontrarse en su forma tautomérica resultante del cambio de posición del protón de dicho grupo hidroxilo, sulfanilo o amino. Tales formas tautoméricas de tales compuestos también forman parte de la presente invención. Hablando de forma más
20 general, también forman parte de la presente invención todas las formas tautoméricas de compuestos de fórmula general (I), en las que R_1 representa un grupo hidroxilo o sulfanilo, y/o X representa un grupo hidroxilo, sulfanilo o amino, así como las formas tautoméricas de los compuestos que pueden usarse opcionalmente como compuestos intermedios en los procedimientos de preparación, y que se definirán en la descripción
25 de estos procedimientos.

De acuerdo con la presente invención, el 2-piridilo se sustituye con R_1 en posición 6 y puede sustituirse con $(X)_n$ en cualquier otra posición, donde X y n son como se definen anteriormente. Preferiblemente, la presente invención se refiere a derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]benzamida de fórmula general (I), en la que pueden
30 seleccionarse las diferentes características en solitario o en combinación como:

- en relación a R^1 , R^1 es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno;
- en relación a n, n es 1 ó 2;
- en relación a X, X es un átomo de halógeno o un alquilo(C_1 - C_8);
- en relación a las posiciones en la que el resto 2-piridilo está sustituido con X,
35 el resto 2-piridilo se sustituye con X en las posiciones 3 y/o 5.

De acuerdo con la presente invención, el fenilo se sustituye en posición orto con R^7 y puede sustituirse con $(Y)_p$ en cualquier otra posición, donde Y y p son como se definen anteriormente. Preferiblemente, la presente invención se refiere a derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]benzamida de fórmula general (I), en la que pueden

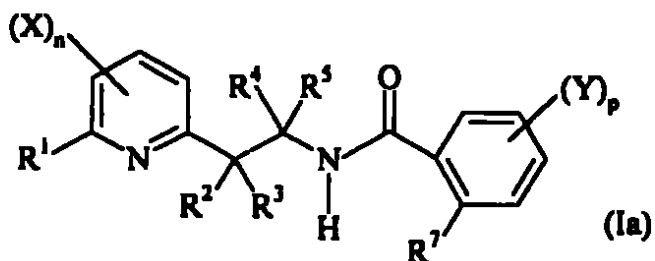
- en relación a R^7 , R^7 es un átomo de halógeno, un alquilo(C_1-C_8) o un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno;

- en relación a p, p es 1 ó 2; Más preferiblemente, p es 1.

- en relación a Y, Y es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, o un alquilo(C_1-C_8). Más preferiblemente Y es un átomo de hidrógeno;

- en relación a las posiciones en las que se sustituye el resto fenilo con Y, el resto fenilo se sustituye con Y preferiblemente primero en posición para.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento (A) para la preparación de compuestos de fórmula general (Ia)

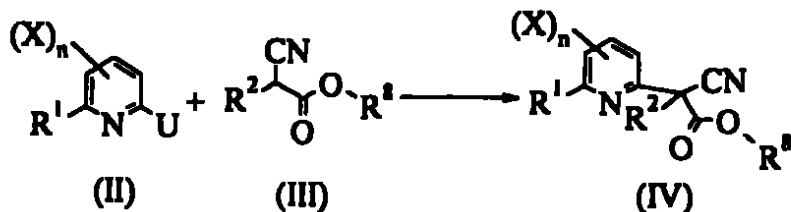


en la que: $-R^1, R^2, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;
 $-R^3$ es un alquilo(C_1-C_8)

que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción A-1:

Esquema A-1:



en la que: $-R^1, R^2, X$ y n son como se definen anteriormente;

$-R^3$ es un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un bencilo, 4

metoxibencilo o pentafluorofenilo;

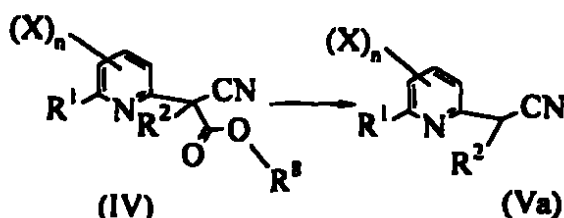
-U es un grupo saliente elegido entre halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato;

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

- una segunda etapa según el esquema de reacción A-2:

Esquema A-2:

10



15

en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;

-R³ es a es un átomo de hidrógeno;

-R⁸ es un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

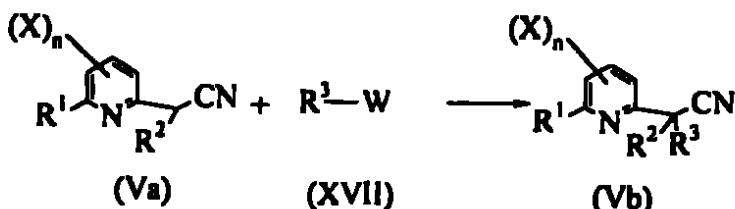
que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento con un haluro de un compuesto de fórmula general (IV), en el mismo o en un recipiente diferente para proporcionar, después de calentar a una temperatura de 40°C a reflujo, un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Va);

20

- una tercera etapa según el esquema de reacción A-3:

Esquema A-3:

25



30

en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;

-R³ es un alquilo(C₁-C₆)

-W es un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato, un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato,

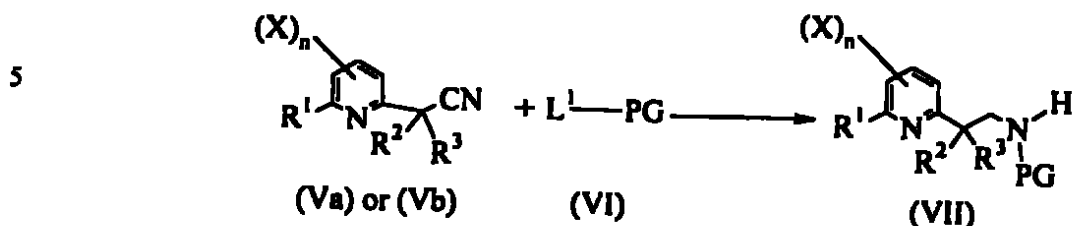
que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (Va) con un reactivo de fórmula general (XVII), para proporcionar un compuesto de fórmula

35

general (Vb);

- una cuarta etapa según el esquema de reacción A-4:

Esquema A-4:



en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;

10 -R³ es un átomo de hidrógeno o un alquilo(C₁-C₆);

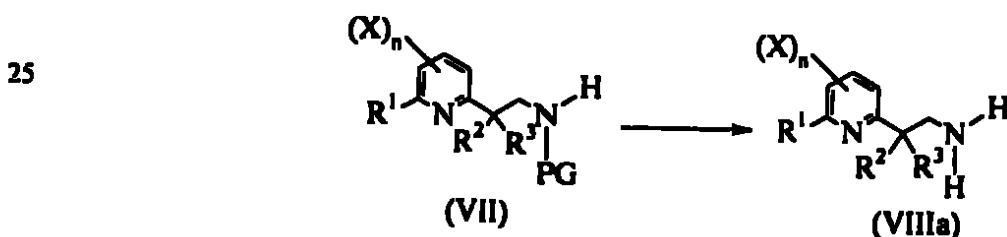
-L¹ es un grupo saliente elegido entre un grupo -OR⁸ o un grupo -OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

-PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, mediante hidrogenación o con un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) ó (Vb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (VI), para producir un compuesto de fórmula general (VII), a una temperatura de 0°C a 150°C y con una presión desde 1 bar a 100 bar;

- una quinta etapa según el esquema de reacción A-5:

Esquema A-5:



en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;

30 -R³ es un alquilo(C₁-C₆)

-PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

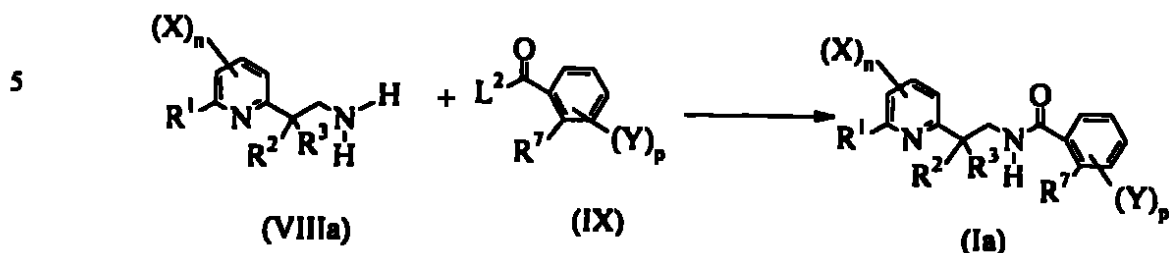
que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o básico, de un compuesto de fórmula general (VII), para proporcionar un derivado de amina de

35

fórmula general (VIIIa) o una de sus sales;

- una sexta etapa según el esquema de reacción A-6:

Esquema A-6:



en el que: $-R^1, R^2, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;

$-R^3$ es un alquilo(C_1-C_6)

$-L^2$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo $-OR^6$, $-OCOR^6$, siendo R^6 un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula



que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIa) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX) para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

La primera etapa (etapa A-1) del procedimiento A según la presente invención se lleva a cabo en presencia de una base. Preferiblemente, la base se elegirá como una base orgánica o inorgánica. Ejemplos adecuados de tales bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o hidrógenocarbonatos, acetatos o aminas terciarias de metales alcalinos y alcalinotérreos.

La primera etapa (etapa A-1) del procedimiento A según la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 200°C . Preferiblemente, la primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 120°C , más preferiblemente a una temperatura de 0°C a 80°C .

La primera etapa (etapa A-1) del procedimiento A según la presente invención puede llevarse a cabo en presencia de un disolvente. Preferiblemente, el disolvente se elige entre agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, disolventes alifáticos, alicíclicos o aromáticos.

La primera etapa (etapa A-1) del procedimiento A según la presente invención

puede también llevarse a cabo en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige como sales o complejos de paladio. Más preferiblemente, el catalizador se elige como un complejo de paladio. El catalizador adecuado de tipo complejo de paladio puede generarse por ejemplo directamente en la mezcla de reacción, adicionando separadamente a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Ligandos adecuados pueden ser por ejemplo ligandos fosfinas o arsinas voluminosos, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etildifenilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-*t*-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos;

La cuarta etapa (etapa A-4) del procedimiento A según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un donante de hidruros. Preferiblemente, el donante de hidruros se elige entre hidruros de metales o metaloides tales como LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

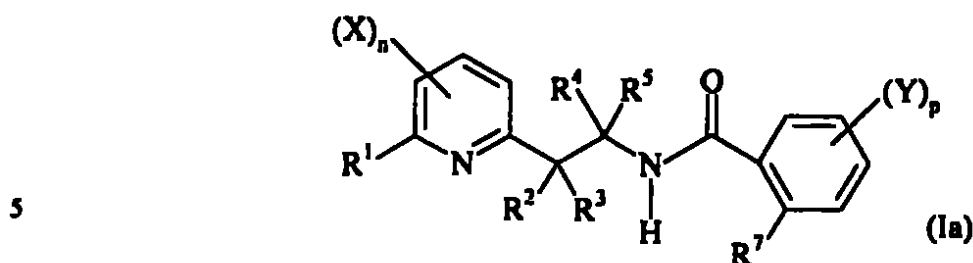
La cuarta etapa (etapa A-4) del procedimiento A según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige como cloruro-Co(II), cloruro-Ni(II), amonio o una de sus sales, Paladio sobre carbón vegetal, níquel Raney, cobalto Raney o platino.

La cuarta etapa (etapa A-4) del procedimiento A según la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 150°C . Preferiblemente, la temperatura es de 10°C a 120°C . Más preferiblemente, la temperatura es de 10°C a 80°C .

La cuarta etapa (etapa A-4) del procedimiento A según la presente invención se lleva a cabo a una presión de 1 bar a 100 bar. Preferiblemente, la presión es de 1 bar a 50 bar.

La cuarta etapa (etapa A-4) del procedimiento según la presente invención puede llevarse a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o una de sus mezclas. Preferiblemente, el disolvente se elige como éter, alcohol, ácido carboxílico, o una mezcla de los mismos con agua o agua pura.

La presente invención también se refiere a otro procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un segundo procedimiento B para la preparación de compuestos de fórmula general (Ia)

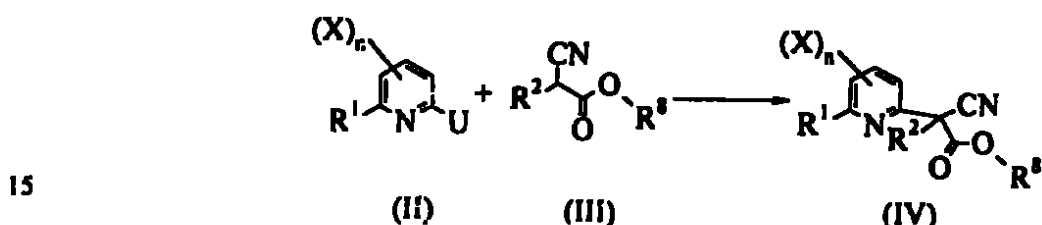


en la que : -R¹, R², R⁷, X, Y, n y p son como se definen anteriormente;
-R³ es un alquilo(C₁-C₆)

que comprende

10 - una primera etapa según el esquema de reacción B-1:

Esquema B-1



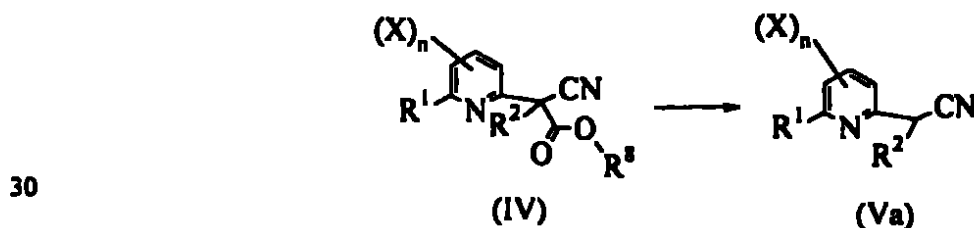
en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;
-R⁸ es un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

20 -U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato;

que comprende la arilación de un derivado de cianoacetato de fórmula general (III) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un derivado de 2-piridilcianoacetato de fórmula general (IV);

25 - una segunda etapa según el esquema de reacción B-2:

Esquema B-2



en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;
-R⁸ es un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

35 que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento con un

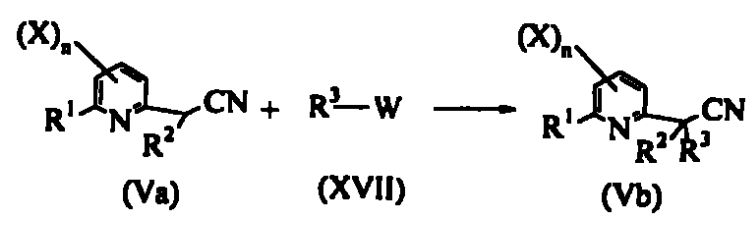
haluro de un compuesto de fórmula general (IV), en el mismo recipiente o en otro para proporcionar, después de calentar a una temperatura de 40°C a reflujo, un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Va);

- una tercera etapa según el esquema de reacción B-3:

5

Esquema B-3

10



en el que: -R¹, R², X y n son como se definen anteriormente;

-R³ es un alquilo(C₁-C₈)

-W es un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonato, un haloalquil(C₁-C₈)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato,

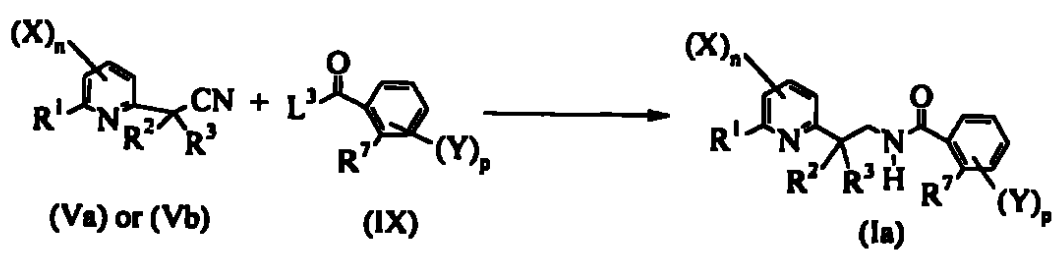
15

que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (Va) mediante un reactivo de fórmula general (XVII), para proporcionar un compuesto de fórmula general (Vb);

- una cuarta etapa según el esquema de reacción B-4:

20

Esquema B-4



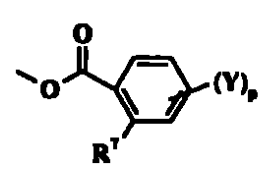
25

en el que: -R¹, R², R³, X, Y, n y p son como se definen anteriormente;

-R³ es un alquilo(C₁-C₈)

-L³ es un grupo saliente elegido entre un grupo -OCOR⁶, siendo R⁶ un alquilo(C₁-C₈), un haloalquilo(C₁-C₈), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; -OCHO, -SCSN(Me)₂ o un grupo de fórmula

30



35

que comprende la reducción, mediante hidrogenación o con un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) o un compuesto de fórmula general (Vb), en

presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (IX), para producir un compuesto de fórmula general (Ia), a una temperatura de 0°C a 150°C y a una presión desde 1 bar a 100 bar;

El compuesto de fórmula general (Ia) según la presente invención puede prepararse según el procedimiento B.

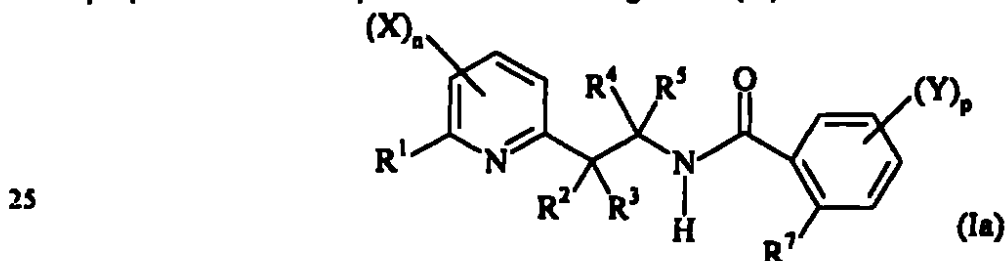
Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa B-1 del procedimiento B son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-1 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa B-2 del procedimiento B son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-2 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa B-3 del procedimiento B son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-3 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa B-4 del procedimiento B son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-4 del procedimiento A anteriormente mencionado.

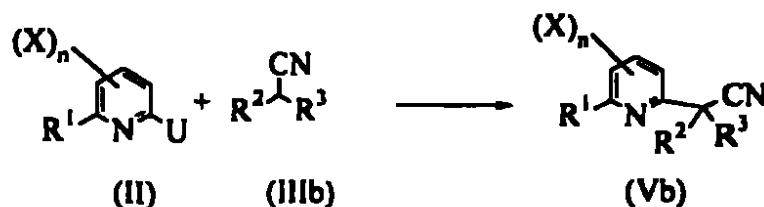
La presente invención también se refiere a otro procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un tercer procedimiento C para la preparación de compuestos de fórmula general (Ia)



- en la que $R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente; que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción C-1:

Esquema C-1



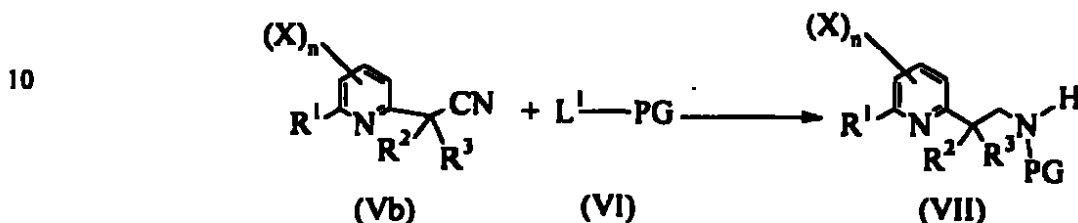
en el que: $-R^1, R^2, R^3, X$ y n son como se definen anteriormente;

-U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (IIIb) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un derivado de 2-piridilacetronitrilo de fórmula general (Vb), en presencia de una base y a una temperatura de -100°C a 200°C;

- una segunda etapa según el esquema de reacción C-2:

Esquema C-2



en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

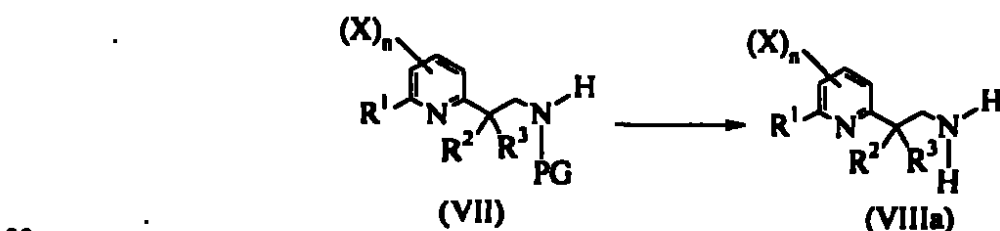
-L¹ es un grupo saliente elegido entre un grupo -OR⁸ o un grupo -OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

-PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, mediante hidrogenación o con un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) ó (Vb), en presencia de un compuesto de fórmula general (VI), para producir un compuesto de fórmula general (VII);

- una tercera etapa según el esquema de reacción C-3:

Esquema C-3



en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

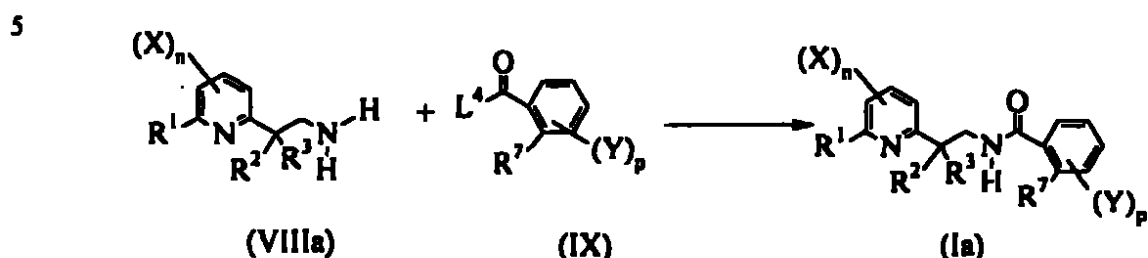
-PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o básico, de un

compuesto de fórmula general (VII), para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIIa) o una de sus sales;

- una cuarta etapa según el esquema de reacción C-4:

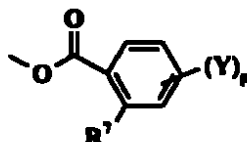
Esquema C-4



en el que: $-R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;

$-L^4$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o

15 un grupo de fórmula



que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIa) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

20

La primera etapa (etapa C-1) del procedimiento C según la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de -100°C a 200°C . Preferiblemente, la primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo a una temperatura de -80°C a 120°C , más preferiblemente a una temperatura de -80°C a 80°C .

25

La primera etapa (etapa C-1) del procedimiento C según la presente invención se lleva a cabo en presencia de una base. Preferiblemente, la base se elige como una base orgánica o inorgánica. Ejemplos adecuados de tales bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o hidrógenocarbonatos, acetatos o aminas terciarias de metales alcalinos y alcalinotérreos.

30

La primera etapa (etapa C-1) del procedimiento C según la presente invención puede llevarse a cabo en presencia de un disolvente. Preferiblemente, el disolvente se elige como agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, disolventes alifáticos, alicíclicos o aromáticos.

35

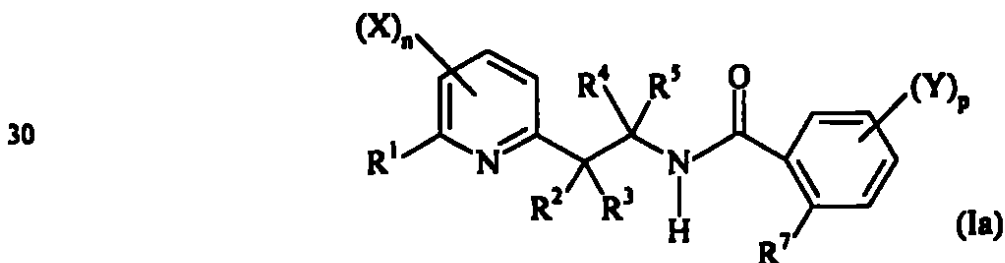
La primera etapa (etapa C-1) del procedimiento C según la presente invención puede también llevarse a cabo en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige como sales o complejos de paladio. Más preferiblemente, el catalizador se elige como un complejo de paladio. El complejo de paladio adecuado pueden generarse, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción adicionando separadamente a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Ligandos adecuados pueden ser por ejemplo ligandos fosfinas o arsinas voluminosos, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-(díciclohexilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(díciclohexilfosfino)ferrocenil]etildifenilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos;

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa C-2 del procedimiento C son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-4 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa C-3 del procedimiento C son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-5 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa C-4 del procedimiento C son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-6 del procedimiento A anteriormente mencionado.

La presente invención también se refiere a otro procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un cuarto procedimiento D para la preparación de compuestos de fórmula general (Ia)



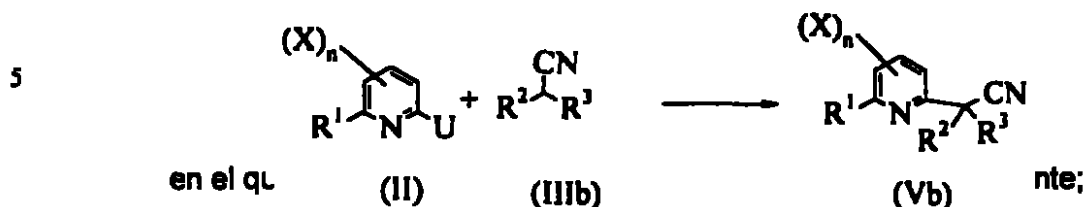
en la que : -R¹, R², R⁷, X, Y, n y p son como se definen anteriormente;
-R³ es un alquilo(C₁-C₆)

35

que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción D-1:

Esquema D-1

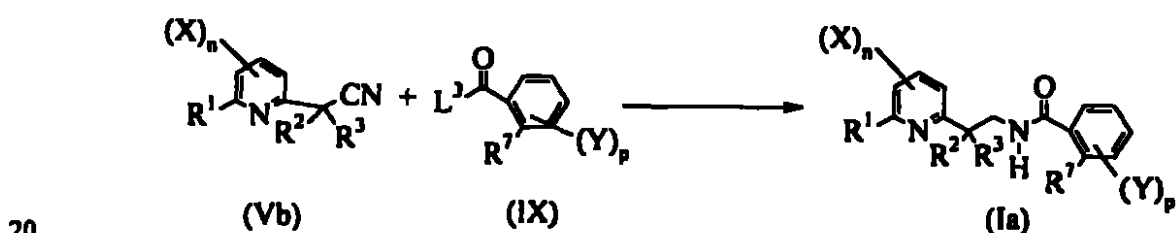


-U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato;

10 que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (IIIb) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Vb), en presencia de una base y a una temperatura de -100°C a 200°C;

- una segunda etapa según el esquema de reacción D-2:

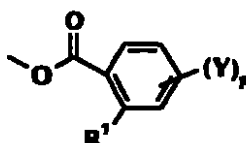
Esquema D-2



20 en el que: -R¹, R², R⁷, X, Y, n y p son como se definen anteriormente;

-R³ es un alquilo(C₁-C₆)

-L³ es un grupo saliente elegido entre un grupo -OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; -OCHO, -SCSN(Me)₂ o un grupo de fórmula



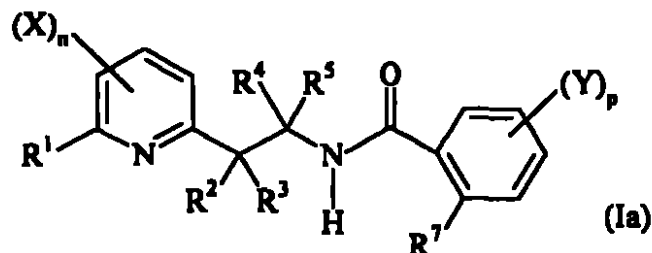
30 que comprende la reducción mediante hidrogenación o con un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) o un compuesto de fórmula general (Vb), en presencia de un compuesto de fórmula general (IX), para producir un compuesto de fórmula general (Ia) ;

35 El compuesto de fórmula general (Ia) según la presente invención puede prepararse según el procedimiento D.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa D-1 del procedimiento D son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa C-1 del procedimiento C anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa D-2 del procedimiento D son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-4 del procedimiento A anteriormente mencionado.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un quinto procedimiento (E) para la preparación de compuestos de fórmula general (Ia)



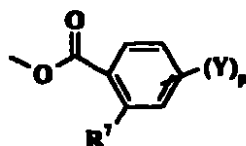
15

en la que : $-R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;

$-R^4$ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);

20

$-R^5$ es un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6); $-L^4$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula

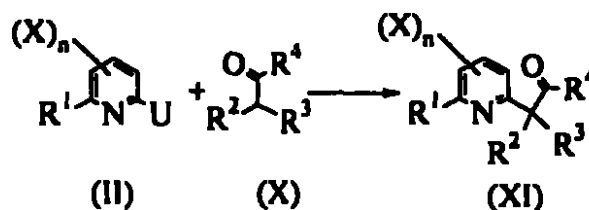


25

que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción E-1:

Esquema E-1



30

en el que: $-R^1, R^2, R^3, X$ y n son como se definen anteriormente;

$-R^4$ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);

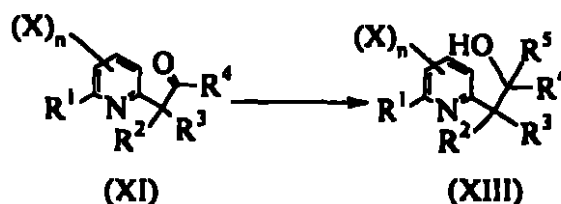
35

-U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (X) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XI);

- una segunda etapa según el esquema de reacción E-2:

Esquema E-2



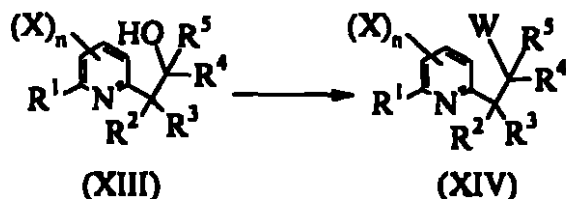
en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

-R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₆) o un haloalquilo(C₁-C₆);

que comprende la conversión de un compuesto de fórmula general (XI) en un compuesto de fórmula general (XIII) mediante adición de un compuesto de fórmula general R⁵-M, en la que R⁵ es un alquilo(C₁-C₆) o un haloalquilo(C₁-C₆) y M es una especie metálica;

- una tercera etapa según el esquema de reacción E-3:

Esquema E-3



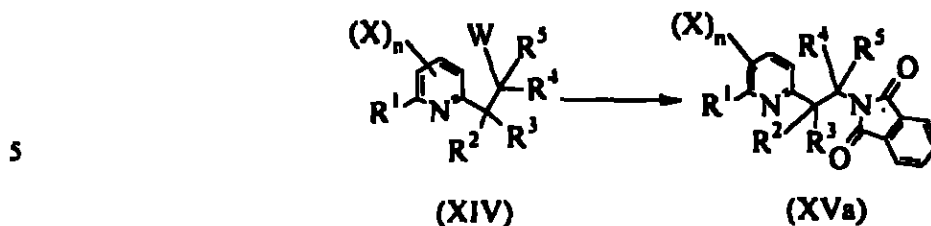
en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

-R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₆) o un haloalquilo(C₁-C₆);

-R⁵ es un alquilo(C₁-C₆) o un haloalquilo (C₁-C₆);

-W es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato; que comprende la activación de un compuesto de fórmula general (XIII), convirtiéndolo en un compuesto de fórmula general (XIV);

- una cuarta etapa según el esquema de reacción E-4:

Esquema E-4

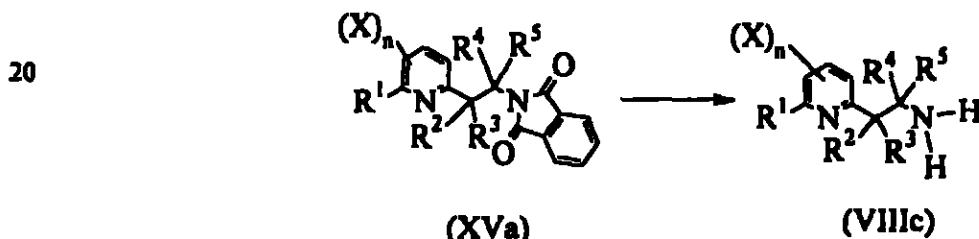
en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

10 -R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo(C₁-C₈);

-R⁵ es un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo (C₁-C₈);

-W es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₈)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato; que comprende la sustitución de un compuesto de fórmula general (XIV) con un derivado de ftalamida o una de sus sales, para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVa);

15 - una quinta etapa según el esquema de reacción E-5:

Esquema E-5

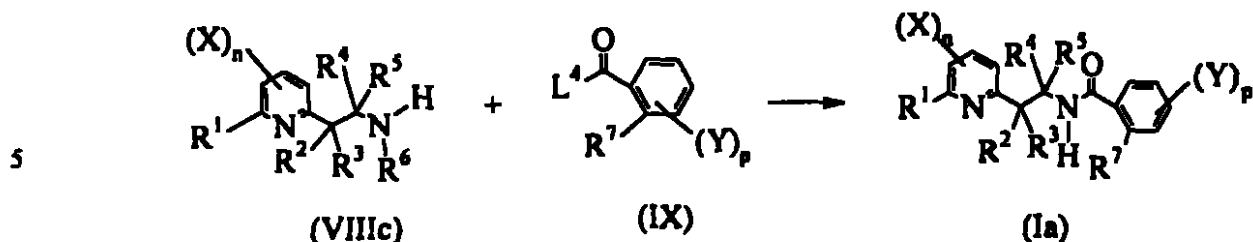
en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

25 -R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo(C₁-C₈);

-R⁵ es un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo (C₁-C₈);

que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (XVa), haciéndolo reaccionar con un hidrato de hidrazina o una sal de hidrazina, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIIc) o una de sus sales;

30 - una sexta etapa según el esquema de reacción E-6:

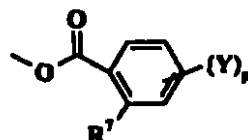
Esquema E-6

en el que: $-R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;

10 $-R^4$ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);

$-R^5$ es un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6); $-L^4$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula

15



que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIb) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

20

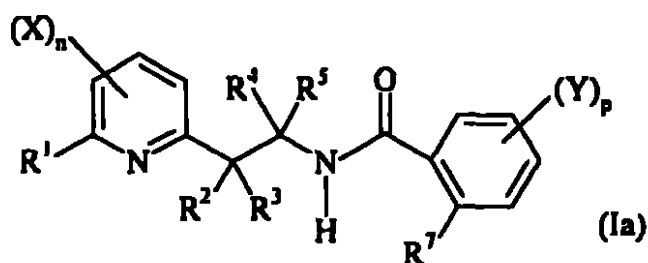
El compuesto de fórmula general (I) según la presente invención puede prepararse según el procedimiento E.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa E-6 del procedimiento E son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-6 del procedimiento A anteriormente mencionado.

25

La presente invención también se refiere a otro procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un sexto procedimiento F para la preparación de compuestos de fórmula general (Ia)

30

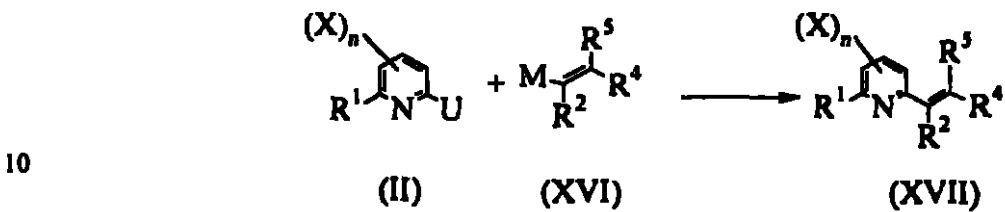


35

en la que : -R¹, R⁷, X, Y, n y p son como se definen anteriormente;
-R², R⁴ y R⁵ se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₆) o haloalquilo(C₁-C₆);
que comprende

5 - una primera etapa según el esquema de reacción F-1:

Esquema F-1

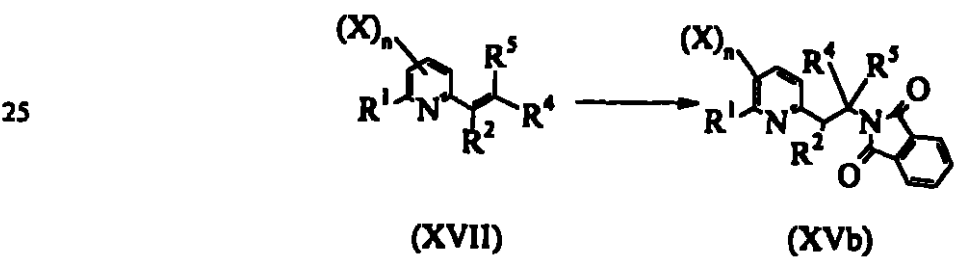


en el que: -R¹, X y n son como se definen anteriormente;
-U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato;
15 -R², R⁴ y R⁵ se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₆) o haloalquilo(C₁-C₆);
-M es una especie metálica o metaloide;

que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de piridina de fórmula general (II) con una especie vinílica de fórmula general (XVI), a una temperatura de
20 0°C a 200°C, para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVII);

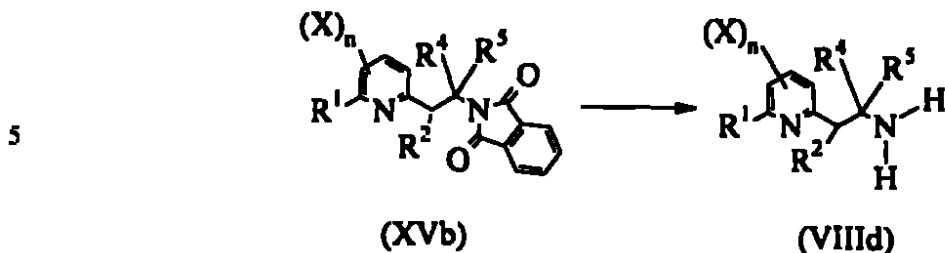
- una segunda etapa según el esquema de reacción F-2:

Esquema F-2



en el que: -R¹, X y n son como se definen anteriormente;
30 -R², R⁴ y R⁵ se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₆) o haloalquilo(C₁-C₆);
que comprende la adición de ftalamida o una de sus sales sobre un compuesto de fórmula general (XVII), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVb);

- una tercera etapa según el esquema de reacción F-3:

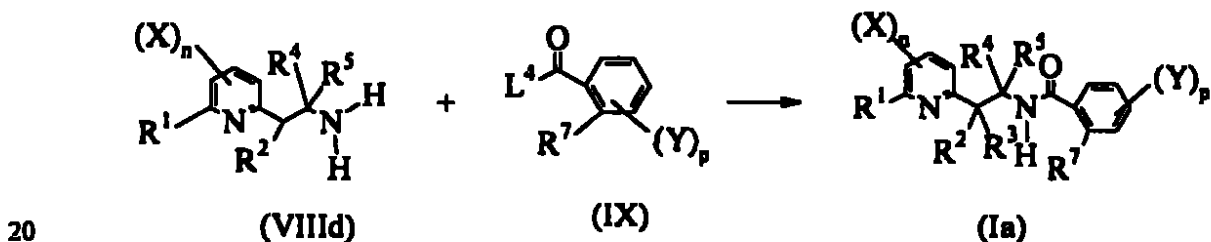
Esquema F-3

en el que: $-R^1$, X y n son como se definen anteriormente;

$-R^2$, R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);
que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (XVb) con un hidrato de hidrazina o una sal de hidrazina, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIId) o una de sus sales;

- una cuarta etapa según el esquema de reacción F-4:

15 **Esquema F-4**



en el que: $-R^1$, R^7 , X, Y, n y p son como se definen anteriormente;

$-R^2$, R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);

$-L^4$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula



que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIb) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

La primera etapa (etapa F-1) del procedimiento F según la presente invención se lleva a cabo en presencia de una especie vinílica de fórmula general (XVI), en la

35

que M puede ser una especie metálica o metaloide. M preferiblemente es un derivado de estaño o un derivado de boro. Más preferiblemente, M es un grupo tri-nbutilestaño.

La primera etapa (etapa F-1) del procedimiento F según la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 200°C. Preferiblemente, la etapa G-1 se
5 lleva a cabo a una temperatura de 80°C a 160°C, más preferiblemente a una temperatura de 80°C a 140°C.

La primera etapa (etapa F-1) del procedimiento F según la presente invención puede llevarse a cabo en presencia de un disolvente. Preferiblemente, el disolvente se elige entre agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Disolventes
10 orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, disolventes alifáticos, alicíclicos o aromáticos.

La primera etapa (etapa F-1) del procedimiento F según la presente invención puede también llevarse a cabo en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige entre sales o complejos de paladio. Más preferiblemente, el
15 catalizador se elige como un complejo de paladio. El complejo de paladio adecuado puede generarse, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción adicionando separadamente a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Ligandos adecuados pueden ser por ejemplo ligandos fosfinas o arsinas voluminosos, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina y su
20 correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etil-difenilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-t-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una
25 mezcla de ambos;

La primera etapa (etapa F-1) del procedimiento F según la presente invención puede también llevarse a cabo en presencia de una base. Preferiblemente, la base se elige como una base orgánica o inorgánica. Ejemplos adecuados de tales bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o
30 hidrógenocarbonatos, acetatos o aminas terciarias de metales alcalinos y alcalinotérreos.

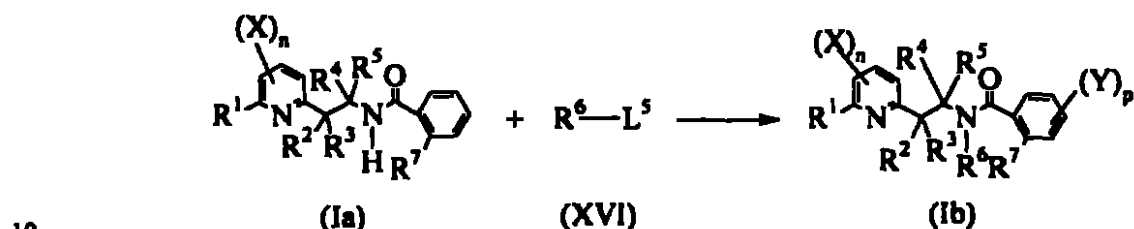
Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa F-3 del procedimiento F son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa E-5 del procedimiento E anteriormente mencionado.

35 Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa F-4 del

procedimiento F son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-6 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Cualquiera de los procedimientos anteriormente descritos A a F puede comprender opcionalmente una etapa adicional según el esquema de reacción G:

5 Esquema G



en el que: $-R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;

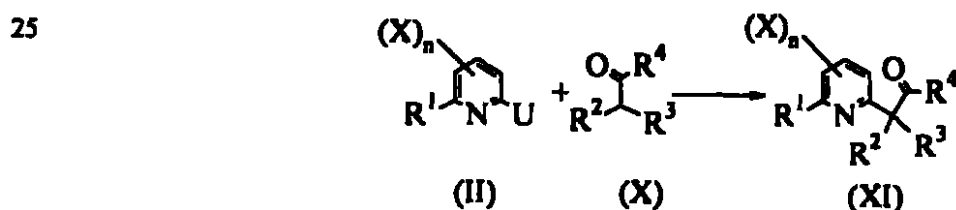
$-L^5$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, 4-metil fenilsulfoniloxi, metilsulfoniloxi;

15 que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ia) con un compuesto de fórmula general (XVI), para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ib).

La presente invención también se refiere a otro procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un séptimo procedimiento H para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se define anteriormente, que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción H-1:

Esquema H-1



30 en el que: $-R^1, R^2, R^3, X$ y n son como se definen anteriormente;

$-R^4$ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);

$-U$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_6)sulfonato;

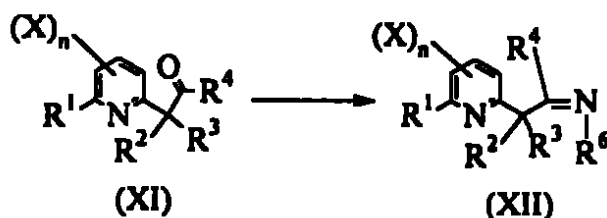
35 que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (X) con un derivado

de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XI), en presencia de una base y a una temperatura de 0°C a 200°C;

- una segunda etapa según el esquema de reacción H-2:

Esquema H-2

5



10

en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

-R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo(C₁-C₈);

-R⁶ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈), un haloalquilo(C₁-C₈), un alcoxi(C₁-C₈) o un cicloalquilo(C₃-C₇);

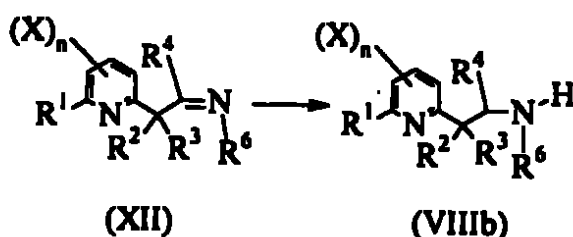
15

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (XI) con una amina de fórmula R⁶-NH₂, para proporcionar un derivado de imina de fórmula general (XII);

- una tercera etapa según el esquema H-3:

Esquema H-3

20



en el que: -R¹, R², R³, X y n son como se definen anteriormente;

25

-R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo(C₁-C₈);

-R⁶ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈), un haloalquilo(C₁-C₈), un alcoxi(C₁-C₈) o un cicloalquilo(C₃-C₇);

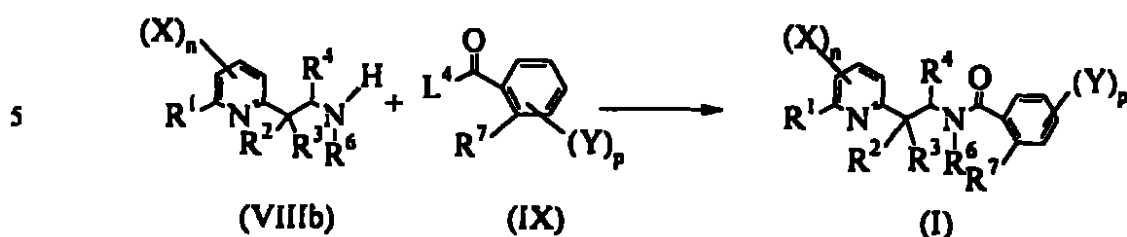
que comprende la reducción de un derivado de amina de fórmula general (XII)

30

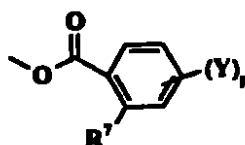
mediante hidrogenación o con un donante de hidruros, en el mismo recipiente o en otro, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIIb) o una de sus sales;

- una cuarta etapa según el esquema de reacción H-4:

35

Esquema H-4

- en el que: $-R^1, R^2, R^3, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen anteriormente;
- 10 $-R^4$ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o un haloalquilo(C_1-C_8);
- $-R^6$ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un alcoxi(C_1-C_8) o un cicloalquilo(C_3-C_7);
- $-L^4$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un
- 15 grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula



que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIb) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (I).

25 El compuesto de fórmula general (I) según la presente invención puede prepararse según el procedimiento H.

Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa H-1 del procedimiento H son las mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-1 del procedimiento A anteriormente mencionado.

30 La tercera etapa (etapa H-3) del procedimiento H según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un donante de hidruros. Preferiblemente, el donante de hidruros se elige entre hidruros de metales o metaloides tales como $LiAlH_4$, $NaBH_4$, KBH_4 , B_2H_6 .

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede prepararse según los procedimientos generales de preparación descritos anteriormente. Deberá

35 entenderse sin embargo que, en base a su conocimiento general y publicaciones

disponibles, el experto en la técnica será capaz de adaptar este método de acuerdo con las características de cada uno de los compuestos que se desean sintetizar.

La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). Así, conforme a la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (I), como se define anteriormente, y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

En la presente memoria descriptiva, el término "soporte" se refiere a un material orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el material activo para hacerlo más fácilmente aplicable, fundamentalmente sobre las partes de la planta. Así, este soporte es generalmente inerte y debería ser aceptable desde el punto de vista agrícola. El soporte puede ser un sólido o un líquido. 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 usar mezclas de tales soportes.

La composición también puede comprender componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender también un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante, de tipo iónico o no iónico o una mezcla de estos tensioactivos. Por ejemplo, se pueden citar, sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenosulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular, alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxietilenados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen grupos funcionales sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es por lo general esencial cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua, y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Con preferencia, 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, agentes secuestrantes. Más generalmente, los

materiales 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 material activo, preferiblemente, de 10 a 70% en peso.

5 Las composiciones conformes a 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,
10 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,
15 concentrado en suspensión (concentrado fluido), líquido de muy bajo volumen (ulv), suspensión de muy bajo volumen (ulv), granulado o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, granulados o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humectable

20 Estas composiciones abarcan no sólo las composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo pulverizador o de aplicación de polvo fino, sino también las composiciones concentradas comerciales que han de diluirse antes de la aplicación al cultivo.

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

30 Las composiciones fungicidas de la presente invención se pueden usar para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatógenos de los cultivos. Así, conforme a otro aspecto de la presente invención, se proporciona un procedimiento para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatógenos de cultivos, caracterizado porque la composición fungicida como se ha descrito en la presente
35 memoria antes, se aplica a la semilla, a la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en

el que crece o en el que se desea que crezca la planta.

La composición tal como la que se usa contra hongos fitopatógenos de los cultivos comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de la fórmula general (I).

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

Esta cantidad se puede determinar por ensayos en campo sistemáticos, que están dentro de las cualidades de un experto en la técnica.

El procedimiento de tratamiento conforme a la presente invención es útil para
15 tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, brotes o siembras de brotes y plantas o siembras de plantas. Este procedimiento de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El procedimiento de tratamiento conforme a la presente 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
20 cuestión.

Entre las plantas que se pueden proteger por el procedimiento conforme a la invención, se pueden citar el algodón; linaza; vid; cultivos frutales 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),
25 *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, árbol del plátano y plataneros), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); cultivos de leguminosas tales como *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por
30 ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, judías), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); grandes cultivos tales como *Graminae* sp. (por ejemplo, maíz, cereales como el trigo, arroz, cebada y triticale), *Asteraceae* sp. (por ejemplo, girasol), *Cruciferae* sp. (por ejemplo, colza), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, soja), *Solanaceae*
35 sp. (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha); cultivos

hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

Entre las plantas y las posibles enfermedades de estas plantas protegidas por el procedimiento conforme a la presente invención, se pueden citar las constituidas por:

- trigo, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: fusaria (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*), carbón cubierto del trigo (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* o *Tilletia indica*), septoriosis (*Septoria nodorum*) y carbón desnudo;

- trigo, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas de la planta: manchas oculares del cereal (*Tapesia yellundae*, *Tapesia acuiformis*), mal del pie (*Gaeumannomyces graminis*), tizón del pie (*F. culmorum*, *F. graminearum*), manchas negras (*Rhizoctonia cereals*), oidios (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), royas (*Puccinia striiformis* y *Puccinia recondita*) y septoriosis (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*);

- trigo y cebada, en lo que se refiere a la lucha contra enfermedades bacterianas y víricas, por ejemplo mosaico amarillo de la cebada;

- cebada, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: manchas reticulares (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), carbón desnudo (*Ustilago nuda*) y fusaria (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*);

- cebada, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas de la planta: mancha ocular del cereal (*Tapesia yellundae*), manchas reticulares (*Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), oidio (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), roya enana (*Puccinia hordei*) y escaldadura de la cebada (*Rhynchosporium secalis*);

- patatas, en lo referente a la lucha contra enfermedades de los tubérculos (en particular *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), mildiu (*Phytophthora infestans*) y ciertos virus (virus Y);

- patata, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de las hojas: tizón temprano (*Alternaria solani*), mildiu (*Phytophthora infestans*);

- algodón, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de plantas jóvenes obtenidas de semillas: caída de almáciga y podredumbre basal (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*), y podredumbre negra de la raíz (*Thielaviopsis basicola*);

- cultivos productores de proteínas, por ejemplo guisantes, en lo referente a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: antracnosis (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), mildiu (*Peronospora pisi*);
- 5 - cultivos productores de aceite, por ejemplo, colza, en lo referente a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* y *Sclerotinia sclerotiorum*;
- maíz, en lo referente a combatir las enfermedades de las semillas: (*Rhizopus sp.*, *Penicillium sp.*, *Trichoderma sp.*, *Aspergillus sp.*, y *Gibberella fujikuroi*);
- 10 - linaza, en lo referente a la lucha contra las enfermedades de las semillas: *Alternaria linicola*;
- árboles forestales, en lo que se refiere a la lucha contra la caída de almáciga (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*);
- arroz, en lo referente a combatir las siguientes enfermedades de las partes
- 15 aéreas: Bruzzone parasitario (*Magnaporthe grisea*), manchas de los bordes de las vainas (*Rhizoctonia solani*);
- cultivos de leguminosas, en lo referente a combatir las siguientes enfermedades de las semillas o de brotes que salen de las semillas: caída de almáciga y podredumbre basal (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium sp.*);
- 20 - cultivos leguminosos, en lo referente a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas: moho gris (*Botrytis sp.*), oídios (en particular *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Leveillula taurica*), fusaria (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), manchas de las hojas (*Cladosporium sp.*),
- 25 alternaria (*Alternaria sp.*), antracnosis (*Colletotrichum sp.*), septoriosis (*Septoria sp.*), manchas negras (*Rhizoctonia solani*), mildius (por ejemplo, *Bremia lactucae*, *Peronospora sp.*, *Pseudoperonospora sp.*, *Phytophthora sp.*);
- árboles frutales, en lo referente a enfermedades de las partes aéreas: enfermedades por monilia (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), roña (*Venturia inaequalis*),
- 30 oídio (*Podosphaera leucotricha*);
- vid, en lo referente a enfermedades de las hojas: en particular moho gris (*Botrytis cinerea*), oídio (*Uncinula necator*), roña negra (*Guignardia biwelli*) y mildiu (*Plasmopara viticola*);
- remolacha, en lo referente a combatir las siguientes enfermedades de las
- 35 partes aéreas: tizón (*Cercospora beticola*), oídio (*Erysiphe beticola*), manchas de las

hojas (*Ramularia beticola*).

La composición fungicida conforme a la presente invención también se puede usar contra enfermedades fúngicas que pueden desarrollarse sobre maderas o en el interior de las mismas. El término "madera" se refiere a todos los tipos de especies de madera, y a todos los tipos de trabajos de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y contrachapado. El procedimiento para tratar la madera conforme a la invención comprende fundamentalmente ponerla en contacto con uno o más compuestos de la presente invención, o una composición conforme a la invención; esto incluye por ejemplo, la aplicación directa, la pulverización, la inmersión, la inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de material activo aplicada normalmente en el tratamiento conforme a la presente invención varía de forma general y ventajosa 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 varía de forma general y ventajosa 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 sobreentiende claramente que las dosis indicadas antes se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Un experto en la técnica sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación conforme a la naturaleza del cultivo a tratar.

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

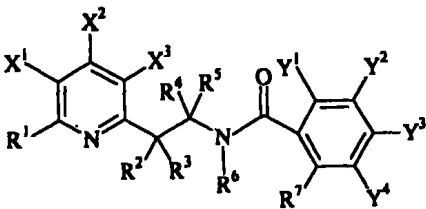
Las composiciones conformes a la presente invención también se pueden usar para la preparación de composiciones útiles para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas de un ser humano o a un animal tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades del género trichophyton y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo, *Aspergillus fumigatus*.

Los aspectos de la presente invención se ilustrarán a continuación con referencia a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. La siguiente tabla ilustra de una forma no limitante ejemplos de compuestos fungicidas conforme a la presente

invención. En los ejemplos siguientes, $M+1$ (ó $M-1$) se refiere al pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.á. (unidades de masa atómica), respectivamente, cuando se observa en espectroscopía de masas y M ($Apcl+$) se refiere al pico del ión molecular que se encontró por ionización química a presión atmosférica positiva en

5 espectroscopía de masas.

5



Compuesto n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
1	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	363
2	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	329
3	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	-	309
4	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	374
5	Cl	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	421
6	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	329
7	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	F	H	H	327	-
8	CH ₃	H	Br	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	388
9	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	309
10	Cl									CF ₃						347

000118

Compuesto n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
11	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	358
12	F	H	F	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	349
13	H	H	Cl	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	347
14	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	367
15	C(Me)=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	366
16	C(Me)=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	458
17	C(Me)=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	400
18	Br	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	387
19	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	374
20	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	329
21	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	405
22	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	455
23	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	397
24	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	387
25	CH=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	444
26	CH=NOMe	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	388
27	CH=NOEt	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	458
28	CH=NOEt	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	400

Compuesto n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
29	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	329
30	CH=NO <i>Pr</i>	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	414
31	CH=NO <i>Pr</i>	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	472
32	CH=NO <i>Pr</i>	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	424
33	CH=NO <i>Pr</i>	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	396
34	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	439
35	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	363
36	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	421
37	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	375
38	Cl	H	Br	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	407
39	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	339
40	Cl	H	Br	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	465
41	H	H	Cl	Cl	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	345
42	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	363
43	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	421
44	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	374
45	F	H	F	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	407
46	Cl	H	F	H	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	329

000120

Compuesto n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
47	F	H	F	F	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	359
48	F	H	F	F	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	315
49	F	Me	F	F	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H	-	309
50	Br	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	406
51	Br	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	466
52	Br	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	419
53	Cl	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	376
54	Cl	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	434
55	Cl	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	386
56	H	H	Cl	Me	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	343
57	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	381
58	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	-	391
59	Cl	H	Cl	F	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	-	347
60	Cl	H	Cl	H	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	377	-
61	Cl	H	Cl	H	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	435	-
62	Cl	H	F	F	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	365
63	Cl	H	F	F	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	423
64	F	H	F	F	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	-	331

000121

Compuesto n°	X ¹	X ²	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	M	(M+1)
65	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	-	401
66	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	343
67	Cl	H	Cl	H	cPr		H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	389
68	Cl	H	H	H	cPr		H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	355
69	Cl	H	Cl	pCl-Ph-CH ₂ S	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	-	519
70	Cl	H	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	Cl	H	F	H	327	-

000122

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

Ejemplo de procedimiento A: Preparación de N-[2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil]-2-(Iodo)benzamida (compuesto 5)

5 **Etapas 1 : Preparación de ciano(3,5-dicloro-2 piridinil)acetato de terc-butilo**

A 50 ml de dimetoxietano se le añadieron lentamente en pequeñas porciones 8,8 g (0,22 mol) de hidruro sódico (dispersión al 60% en aceite mineral) a 0°C.

A esta suspensión se añadieron adicionalmente gota a gota 17 g (0,12 mol) de cianoacetato de *terc*-butilo en 50 ml de dimetoxietano a 5°C. La suspensión se agitó
10 durante 45 min a temperatura ambiente.

Se añadieron sucesivamente a la suspensión 20 g (0,11 mol) de 2,3,5-tricloropiridina, 0,59 g (1,1 mmol) de (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-*terc*-butilfosfina y 1,2 g (2,2 mmol) de bis(dibencilidenoacetona)paladio(0).

La mezcla negra se calentó a reflujo durante 5 horas. Después de enfriar, la
15 mezcla de reacción se vertió en 100 ml de ácido clorhídrico 1N. La fase acuosa se filtró en supersel y se extrajo con acetato de etilo (3 x 200 ml). La fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida, para proporcionar 38,5 g del producto crudo como un aceite marrón.

El producto crudo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de
20 sílice (eluyente: heptano/cloroformo: 6/4), para proporcionar ciano(3,5-dicloro-2-piridinil)acetato de *terc*-butilo: 13 g (41%) como un aceite amarillo; espectro de masas: 287 (M+1).

Etapas 2 : Preparación de (3,5-dicloro-2 piridinil)acetonitrilo

A una disolución de 12 g (0,042 mol) de ciano(3,5-dicloro-2-piridinil)acetato de
25 *terc*-butilo en 50 ml de una mezcla 25/1 de dimetilsulfóxido/agua , se añadieron 1,2 g (0,021 mol) de cloruro sódico.

La mezcla se agitó durante 3 horas a 130°C. Después de enfriarse, la mezcla de reacción se vertió en agua helada. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 250 ml), y la fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de
30 magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida, para proporcionar 8,2 g del producto crudo como un aceite marrón.

El producto crudo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 7/3) para proporcionar (3,5-dicloro-2-piridinil)acetonitrilo: 5,9 g (76%) como un aceite naranja; espectro de masas: 185 (M-
35 1).

Etapas 3 : Preparación de 2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etilcarbamato de terc-butilo

A una disolución de 2,8 g (0,015 mol) de (3,5-dicloro-2-piridinil)acetonitrilo en 40 ml de metanol se añadieron rápidamente 3,9 g (0,0165 mol) de cloruro de cobalto(II) hexahidratado y 6,5 g (0,03 mol) de di-carbonato de di-*terc*-butilo.

5 La disolución oscura se enfrió a - 5°C, y se añadieron 3,96 g (0,1 mol) de borohidruro de sodio en pequeñas porciones a 0°C. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas.

La mezcla de reacción se neutralizó con ácido clorhídrico 1 N, y se separó metanol a presión reducida. La fase acuosa se reextrajo con diclorometano y la fase
10 orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida, para proporcionar 4 g del producto crudo como un aceite marrón.

El producto crudo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 5/1) para proporcionar 2-(3,5-dicloro-2-
15 piridinil)etilcarbamato de *terc*-butilo: 2,0 g (46%) como un aceite amarillo; espectro de masas: 192 (M+1-101 (boc)).

Etapas 4.- Preparación de hidrocloreuro de 2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etanamida

A una disolución de 2,4 g (8,2 mmol) de 2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil carbamato de *terc*-butilo en 100 ml de diclorometano se añadieron 5 ml de ácido trifluoroacético.

20 La mezcla se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar 4,7 g de un aceite amarillo crudo.

El aceite crudo se redisolvió en 10 ml de etil éter y se añadieron gota a gota 5,2 ml de ácido clorhídrico 2N para precipitar el hidrocloreuro.

Se recogió el sólido por filtración, se lavó con etil éter y se secó a vacío, para
25 proporcionar 2-(3,5-dicloro-2-piridinil) etanamina como su hidrocloreuro: 1,3 g (70%).

Etapas 5: Preparación de N-[2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil-2-(iodo)benzamida (compuesto 5)]

A una suspensión de 60 mg (0,26 mmol) del hidrocloreuro de 2-(3,5-dicloro-2-
30 piridinil)etanamina en 1 ml de diclorometano se añadieron sucesivamente 81 µl (0,58 mmol) de trietilamina y 85 mg (0,32 mmol) de cloruro de 2-iodobenzóilo. La mezcla se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente.

La mezcla de reacción se vertió en agua, y se llevó el pH a 4. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo, y la fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio.

35 Se evaporó el disolvente, y se purificó el residuo mediante cromatografía

ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2) para proporcionar N-[2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil]-2-(iodo)benzamida como un sólido marrón: 47 mg (43%) ; m.p. = 133°C.

Se prepararon los siguientes compuestos de fórmula (I) según un procedimiento idéntico al usado para la preparación del compuesto 5, e ilustran asimismo la presente invención: 2, 3, 4, 13, 16, 17, 21, 22, 23, 25 y 26.

Ejemplo de procedimiento B: Preparación de N-[2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil-2-(trifluorometil)]benzamida (compuesto 1)

Etapas 1 : Preparación de ciano(3,5-dicloro-2 piridinil)acetato de metilo

10 A 100 ml de 1-metil-2-pirrolidinona se le añadieron lentamente en pequeñas porciones 24,8 g (0,62 mol) de hidruro sódico (dispersión al 80% en aceite mineral) a 0°C.

A esta suspensión se añadieron adicionalmente gota a gota 32,7 g (0,33 mol) de cianoacetato de metilo en 50 ml de 1-metil-2-pirrolidinona a 5°C.

15 La suspensión se agitó durante 30 minutos a 5°C. A la suspensión enfriada se le añadieron rápidamente 70 g (0,3 mol) de 2-bromo-3,5-dicloropiridina, y la mezcla se calentó a 130°C durante 5 horas. Después de enfriarse, la mezcla de reacción se vertió en agua helada. La fase acuosa se extrajo con etil éter (3 x 300 ml), y la fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio.

20 El disolvente se evaporó a presión reducida y el producto crudo se recrystalizó en metanol, para proporcionar 24,8 g (34%) de ciano(3,5-dicloro-2-piridinil)acetato de metilo como cristales marrones; m.p. = 109-110°C.

Etapas 2 : Preparación de (3,5-dicloro-2 piridinil)acetonitrilo

25 A una disolución de 14,45 g (0,06 mol) de ciano(3,5-dicloro-2-piridinil)acetato de metilo en 70 ml de una mezcla 25/1 de dimetilsulfóxido/agua, se añadieron 1,75 g (0,03 mol) de cloruro sódico.

La mezcla se agitó durante 4 horas a 130°C. Después de enfriarse, la mezcla de reacción se vertió en agua helada. La fase acuosa se extrajo con etil éter (3 x 250 ml), y la fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar 11,2 g del producto crudo como un aceite marrón.

30 El producto crudo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 7/3) para proporcionar (3,5-dicloro-2-piridinil)acetonitrilo: 8,65 g (77%) como un aceite amarillo; espectro de masas: 185 (M-1).

Etapas 3: Preparación de N-[2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil]-2-(trifluorometil)benzamida (compuesto 1)

A una disolución de 1 g (5,4 mmol) de (3,5-dicloro-2-piridinil)acetonitrilo en 15 ml de metanol se añadieron rápidamente 1,3 g (5,9 mmol) de cloruro de cobalto(II) hexahidratado y 3,9 g (10,8 mmol) de anhídrido 2-trifluorometilbenzoico.

La disolución verde oscura se enfrió a - 5°C y se añadieron en pequeñas porciones 1,4 g (37,4 mmol) de borohidruro sódico a 0°C.

La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. La mezcla de reacción se neutralizó con ácido clorhídrico 1 N y se separó metanol a presión reducida. La fase acuosa se reextrajo con acetato de etilo, y la fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar 2,6 g del producto crudo como un aceite marrón.

El producto crudo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 7/3) para proporcionar N-[2-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil]-2-(trifluorometil) benzamida: 0,80 g (41%) como cristales blancos; m.p. = 118°C.

Se prepararon los siguientes compuestos de fórmula (I) según un procedimiento idéntico al usado para la preparación del compuesto 1, e ilustran asimismo la presente invención: 10, 11, 12 y 15.

Ejemplo de procedimiento C/D: Preparación de N-[2-(3-cloro-2-piridinil)etil]-2-(trifluorometil)benzamida (compuesto 6)

Etapas 1 : Preparación de (3-cloro-2 piridinil)acetonitrilo

A una disolución de 55,5 ml (0,138 mol) de butil litio 2,5 M en 400 ml de tetrahidrofurano anhidro a -78°C, se añadieron 6,22 g (0,153 mol) de acetonitrilo. La mezcla de reacción se agitó durante 45 min a -78°C hasta la formación de una suspensión.

A la suspensión resultante, se añadió poco a poco una disolución de 3 g (0,02 mol) de 2,3-dicloropiridina en 50 ml de tetrahidrofurano anhidro a -78°C, y la mezcla de reacción se agitó adicionalmente 2 horas a -78°C.

La mezcla de reacción se vertió en 50 ml de agua. La fase acuosa se extrajo con diclorometano, y la fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio.

Se evaporó el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: diclorometano) para proporcionar (3-cloro-2-piridinil)acetonitrilo como un aceite: 1,2 g (40%); espectro de

masas: 153 (M+1).

Etapas 2: Preparación de N-[2-(3-cloro-2-piridinil)etil]-2-(trifluorometil)benzamida (compuesto 6)

A una disolución de 0,152 g (1 mmol) de (3-cloro-2-piridinil)acetonitrilo en 4 ml de metanol se añadieron sucesivamente 0,238 g (1 mmol) de cloruro de níquel(II) hexahidratado, 0,724 g (2 mmol) de anhídrido 2-trifluorometilbenzoico y se añadieron lentamente a 0°C, 0,265 g (7 mmol) de borohidruro sódico.

La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. Se evaporó el disolvente, y el residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 9/1) para proporcionar N-[2-(3-cloro-2-piridinil)etil]-2-(trifluorometil)benzamida como un aceite: 90 g (27%); espectro de masas: 329 (M+1).

Se prepararon los siguientes compuestos de fórmula (I) según un procedimiento idéntico al usado para la preparación del compuesto 6, e ilustran asimismo la presente invención: 7, 8 y 9.

Ejemplo de procedimiento G: Preparación de N-[2-(5-metil-2-piridinil)etil]-2-(iodo)benzamida (compuesto 14)

Etapas 1: Preparación de 5-metil-2-vinilpiridina

A una disolución de 3 g (17,4 mmol) de 2-bromo-5-metilpiridina en 30 ml de dimetilformamida se añadieron sucesivamente 2 g (1,7 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio y 5,52 g (17,4 mmol) de tributil(vinil)estaño. La mezcla de reacción se agitó durante 18 horas a 120°C. Después de enfriar, la mezcla de reacción se vertió en 50 ml de agua saturada con fluoruro de potasio y se agitó durante 1 hora.

La mezcla se filtró en supersel y se extrajo la fase acuosa con etil éter. La fase orgánica se lavó dos veces con agua saturada con fluoruro potásico, una vez con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar 3,5 g de una mezcla cruda como un aceite amarillo.

La mezcla se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 4/1) para proporcionar 5-metil-2-vinilpiridina como un aceite amarillo: 0,9 g (43%); espectro de masas: 120 (M+1).

Etapas 2: Preparación de 2-[2-(5-metil-2-piridinil)etil]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona

0,5 g (4,2 mmol) de 5-metil-2-vinilpiridina y 0,618 g (4,2 mmol) de ftalamida se añadieron a 0,5 ml de hidróxido de benciltrimetilamonio (Triton BTM), y la mezcla se calentó a 200°C durante 3 horas.

Se dejó que la mezcla se enfriase hasta temperatura ambiente y se purificó directamente mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 5/1) para proporcionar 2-[2-(5-metil-2-piridinil)etil]-1*H*-isoindol-1,3(2*H*)-diona como cristales blancos: 0,680 g (59%); espectro de masas: 267 (M+1).

Etapas 3 : Preparación de 2-(5-metil-2-piridinil)etanamina

A una disolución de 0,5 g (1,88 mmol) de 2-[2-(5-metil-2-piridinil)etil]-1*H*-isoindol-1,3(2*H*)-diona en 5 ml de metanol se añadieron 0,45 g (7,5 mmol) de hidrato de hidrazina. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante una hora hasta completarse.

Se separó el disolvente a vacío, y se acidificó el residuo con ácido clorhídrico 1*N*. La ftalhidrazida sólida se separó mediante filtración. Se basificó el filtrado con hidróxido sódico y se extrajo con cloroformo. La fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio.

Se evaporó el disolvente para proporcionar 2-(5-metil-2-piridinil)etanamina pura como un aceite amarillo: 0,240 g (94%); espectro de masas: 137 (M+1).

Etapas 4 : Preparación de N-[2-(5-metil-2-piridinil)etil-2-(iodo)benzamida (compuesto 14)]

A 0,06 mg (0,44 mmol) de 2-(5-metil-2-piridinil)etanamina en disolución en 3 ml de acetonitrilo se añadieron sucesivamente 0,117 mg (0,44 mmol) de cloruro de 2-iodobenzoilo y 0,078 mg (0,44 mmol) de carbonato de potasio.

La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. La mezcla de reacción se vertió en carbonato potásico acuoso y se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio.

Se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar N-[2-(5-metil-2-piridinil)etil]-2-(iodo)benzamida pura como cristales de color beis: 0,08 g (53%); espectro de masas: 367 (M+1).

Se prepararon los compuestos 18, 19, 20 y 24 según un procedimiento idéntico al usado para la preparación del compuesto 14, e ilustran asimismo la presente invención.

Ejemplos de actividad biológica del compuesto de fórmula general (I)**Ejemplo A : ensayo in vivo en *Alternaria brassicae* (mancha negra de las crucíferas)**

El ingrediente activo ensayado se prepara en un homogeneizador de potter en una formulación de tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión a
5 continuación se diluye en agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de rábanos (variedad Pernot) en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se tratan en el estado cotiledóneo pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

10 Las plantas, usadas como controles, 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 *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm³). Las esporas se han obtenido en un cultivo de 12 a 13 días.

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

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

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total a
20 una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 24, 25, 26, 27, 28, 30, 31, 32, 34, 35, 36, 37, 38, 40, 41, 43, 45, 47, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 67 y 68.

Ejemplo B : ensayo in vivo en *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (oidio de trigo)

El ingrediente activo ensayado se prepara en un homogeneizador de potter en
25 una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión a continuación se diluye en agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de trigo (variedad Audace) en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 12°C, se tratan en la etapa de 1 hoja
30 (10 cm), pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

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

Después de 24 horas, las plantas se contaminan espolvoreándolas con esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, realizándose el espolvoreado usando
35 plantas contaminadas.

La clasificación se lleva a cabo 7 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total a una dosis de 330ppm con los siguientes compuestos: 1, 3, 4, 5, 6, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 18, 38, 50, 43 y 45.

Ejemplo C : ensayo in vivo en *Botrytis cinerea* (moho gris del pepino)

El ingrediente activo ensayado se prepara en un homogeneizador de potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión a continuación se diluye en agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de pepino (variedad Marketer) en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se tratan en el estado cotiledóneo Z11 pulverizándolos con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, 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 obtuvieron de un cultivo de 15 días y se suspendieron en una disolución de nutrientes compuesta de

- 20 g/l de gelatina
- 50 g/l de azúcar de caña
- 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 50%) o total a una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 9, 10, 13, 18, 21, 22, 23, 25, 26, 27, 28, 29, 32, 34, 35, 38, 40, 43, 44, 45, 46, 47, 50, 51, 52, 53, 57 y 62.

Ejemplo D : ensayo in vivo en *Pyrenophora teres* (manchas reticuladas de la cebada)

El ingrediente activo ensayado se prepara en un homogeneizador de potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión a continuación se diluye en agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de cebada (variedad Express) 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), pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

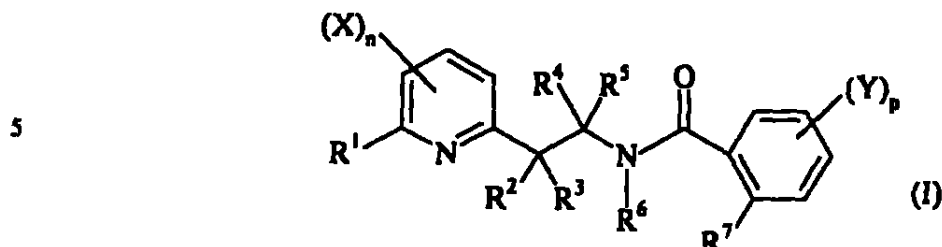
Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se obtuvieron de un cultivo de 12 días. Las plantas de cebada contaminadas se incubaron durante 24 horas a aproximadamente 20°C y a 100% de humedad relativa y a continuación durante 12 días a 80% de humedad relativa.

La clasificación se lleva a cabo 12 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control. En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total a una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: 1, 2, 3, 4, 5, 9, 10, 11, 12, 13, 16, 18, 19, 21, 28, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 65, 67, y 68.

El compuesto N-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-4-fenilbenzamida descrito en la solicitud de patente WO 01/11965 (véase el compuesto 316 en la tabla D) mostraba una eficacia deficiente sobre la *Alternaria brassicae*, y eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm; el N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-3-nitrobenzamida también descrito en la solicitud de patente WO 01/11965 (véase el compuesto 307 en la tabla D), mostraba una eficacia deficiente sobre la *Alternaria brassicae*, y eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm; el N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-benzamida y el N-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-benzamida también descritos en la solicitud de patente WO 01/11965 (véanse los compuestos 304 y 314 en la Tabla D), mostraban eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm; y el N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-4-clorobenzamida, el N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-2-bromobenzamida y el N-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-4-metoxibenzamida, también descritos en la solicitud de patente WO 01/11965 (véanse los compuestos 306, 310 y 315 en la Tabla D) mostraban eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general (1):



en la que

- n es 1, 2 ó 3;

- 10 - X es igual o diferente y es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un grupo alquilo(C₁-C₈), un
- 15 grupo alquenoil(C₂-C₈), un grupo alquinoil(C₂-C₈), un grupo alquil(C₁-C₈)amino, un grupo di-alquil(C₁-C₈)amino, un grupo alcoxi(C₁-C₈), un grupo halogenoalcoxi(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenoil(C₂-C₈)oxi, un halogenoalquenoil(C₂-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinoil(C₂-C₈)oxi, un
- 20 halogenoalquinoil(C₂-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo(C₃-C₈), un halogenocicloalquilo(C₃-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un di-alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un (N-alquil(C₁-C₈))oxicarbamoilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo, un (N-alquil(C₁-C₈))-alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un
- 25 alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilamino, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilamino de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un di-alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un alquil(C₁-C₈)oxicarboniloxi, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfinilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi(C₁-C₈))imino)-alquilo(C₁-C₈), un (alquenoil(C₁-C₈))oxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un (alquinoil(C₁-C₈))oxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un (benciloxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un
- 30
- 35

fenilsulfanilo o un fenilamino;

- R¹ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁸-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un alquilo(C₁-C₈), un alquenilo(C₂-C₈), un alquinilo(C₂-C₈), un alquil(C₁-C₈)amino, un di-alquil(C₁-C₈)amino, un alcoxi(C₁-C₈), un halogenoalcoxi(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil(C₂-C₈)oxi, un halogenoalquenil(C₂-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil(C₃-C₈)oxi, un halogenoalquinil(C₃-C₈)oxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo(C₃-C₈), un halogenocicloalquilo(C₃-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbamoilo un di-alquil(C₁-C₈)carbamoilo, un N-alquil(C₁-C₈)oxicarbamoilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo, un N-alquil(C₁-C₈)-alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carbonilamino, un halogenoalquil(C₁-C₈)carbonilamino de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un di-alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi, un alquil(C₁-C₈)oxicarboniloxi, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfinilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi(C₁-C₈)imino)-alquilo(C₁-C₈), un (alquenil(C₁-C₈)oxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un (alquinil(C₁-C₈)oxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un (benciloxiimino)-alquilo(C₁-C₈), un benciloxi, un bencilsulfanilo opcionalmente sustituido con 1 a 5 átomos de halógeno, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo opcionalmente sustituido con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilamino;

con la condición que X y R¹ no sean ambos un átomo de hidrógeno;

- R² y R³ son iguales o diferentes y son un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo(C₁-C₈), un halogenoalquilo(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo(C₂-C₈), un alcoxi(C₁-C₈), un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un alquil(C₁-C₈)sulfinilo, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi o un alquil(C₁-C₈)carbonilamino;

- o R² y R³ pueden formar juntos un carbociclo de 3, 4, 5 ó 6 miembros;

- R^4 y R^5 son iguales o diferentes y son un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo(C_1-C_8) o un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno;

o R^4 y R^5 pueden formar juntos un carbociclo de 3, 4, 5 ó 6 miembros;

5 - R^6 es un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxil, un alquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C_1-C_8), un halogenoalcoxi(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo(C_3-C_6), un halogenocicloalquilo(C_3-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenoilo(C_2-C_8), un alquinoilo(C_2-C_8), un alcoxi(C_1-C_8)-alquilo(C_1-C_8), un cianoalquilo(C_1-C_8), un aminoalquilo(C_1-C_8), un alquil(C_1-C_8)amino-alquilo(C_1-C_8), un
10 di-alquil(C_1-C_8)amino-alquilo(C_1-C_8), un alquil(C_1-C_8)carbonilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)oxycarbonilo, un benciloxycarbonilo, un alcoxi(C_1-C_8)-alquil(C_1-C_8)carbonilo, un alquil(C_1-C_8)sulfonilo o un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno;

15 - p es 1, 2, 3 ó 4;

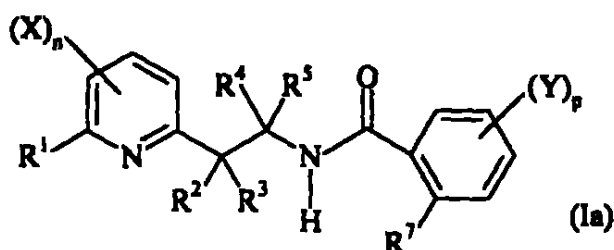
- Y es igual o diferente y es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxil, un grupo formilamino, un grupo carboxil, un alquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5
20 átomos de halógeno, un alquenoilo(C_2-C_8), un alquinoilo(C_2-C_8), un alquil(C_1-C_8)amino, un di-alquil(C_1-C_8)amino, un alcoxi(C_1-C_8), un halogenoalcoxi(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C_1-C_8)-alquenoilo(C_2-C_8), un alquil(C_1-C_8)sulfanilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C_1-C_8)carbonilo, un halogenoalcoxi(C_1-C_8)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un
25 alquil(C_1-C_8)carboniloxil, un halogenoalquil(C_1-C_8)carboniloxil de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)sulfenilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)sulfinilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C_1-C_8)-sulfonilo, un halogenoalquil(C_1-C_8)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno o una alquil(C_1-C_8)sulfonamida; y

30 - R^7 es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxil, un grupo formilamino, un grupo carboxil, un alquilo(C_1-C_8), un halogenoalquilo(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenoilo(C_2-C_8), un alquinoilo(C_2-C_8), un alquil(C_1-C_8)amino, un di-alquil(C_1-C_8)amino, un alcoxi(C_1-C_8), un
35 halogenoalcoxi(C_1-C_8) de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C_1-C_8)-alquenoilo(C_2-C_8),

un alquil(C₁-C₈)sulfanilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi(C₁-C₈)carbonilo, un halogenoalcoxi(C₁-C₈)carbonilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)carboniloxi, un halogenoalquil(C₁-C₈)carboniloxi de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfenilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfenilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfinilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfinilo de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonilo, un halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo de 1 a 5 átomos de halógeno o una alquil(C₁-C₈)sulfonamida;

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

2. Un compuesto según la reivindicación 1, caracterizado porque R¹ es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.
3. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque n es 1 ó 2.
4. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque X es un átomo de halógeno, o un alquilo(C₁-C₈).
5. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque el 2-piridilo está sustituido con X en las posiciones 3 y/o 5.
6. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque R⁷ es un átomo de halógeno, un alquilo(C₁-C₈) o un halogenoalquilo(C₁-C₈) de 1 a 5 átomos de halógeno.
7. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque p es 1 ó 2.
8. Un compuesto según la reivindicación 7, caracterizado porque p es 1.
9. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado porque Y es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un alquilo(C₁-C₈).
10. Un compuesto según la reivindicación 9, caracterizado porque Y es un átomo de hidrógeno.
11. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizado porque el fenilo está sustituido con Y, preferentemente primero en posición para.
12. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia):



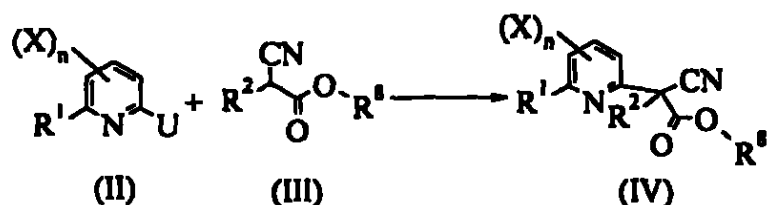
en la que : - R¹, R², R⁷, X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación

1;

- R^3 es un alquilo(C_1-C_6)

que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción A-1:

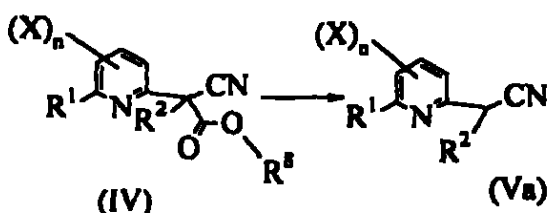
5 Esquema A-1:

10

en el que: - R^1 , R^2 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;- R^3 es un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;15 - U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_6)sulfonato;

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

20 - una segunda etapa según el esquema de reacción A-2:

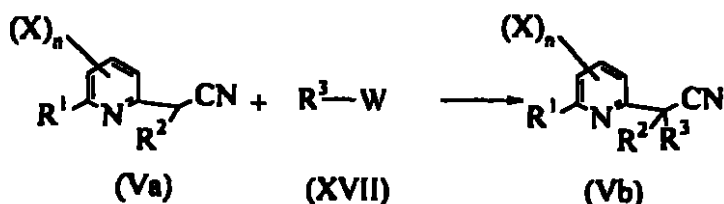
Esquema A-2:

25

en el que: - R^1 , R^2 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;- R^3 es un átomo de hidrógeno;30 - R^3 es un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento con un haluro de un compuesto de fórmula general (IV), en el mismo recipiente o en otro para proporcionar, después de calentar a una temperatura de 40°C a reflujo, un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Va);

35 - una tercera etapa según el esquema de reacción A-3:

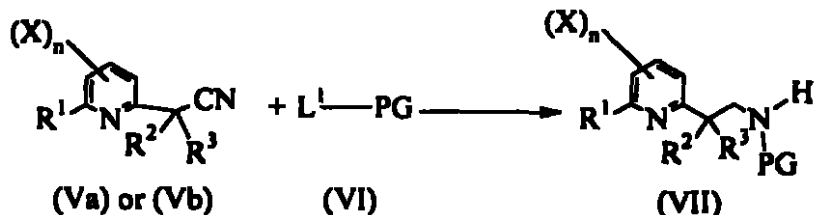
Esquema A-3:

en el que: - R¹, R², X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- R³ es un alquilo(C₁-C₆)

- W es un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₆)sulfonato, un haloalquil(C₁-C₆)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato, que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (Va) mediante un reactivo de fórmula general (XVII), para proporcionar un compuesto de fórmula general (Vb);

- una cuarta etapa según el esquema de reacción A-4:

Esquema A-4:

en el que: - R¹, R², X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- R³ es un átomo de hidrógeno o un alquilo(C₁-C₆);

- L¹ es un grupo saliente elegido entre un grupo -OR⁸ o un grupo -OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

- PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, mediante hidrogenación o con un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) ó (Vb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (VI), para producir un compuesto de fórmula general (VII), a una temperatura de 0°C a 150°C y con una presión desde 1 bar a 100 bar;

- una quinta etapa según el esquema de reacción A-5:

Esquema A-5:

5

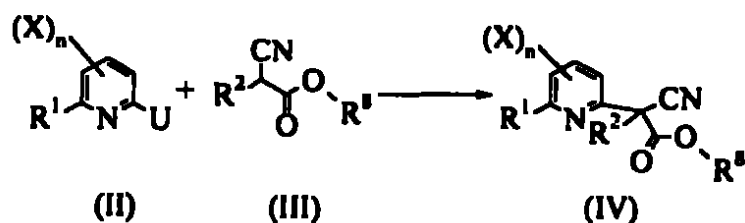
en la que : $-R^1, R^2, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen en la reivindicación 1;

$-R^3$ es un alquilo(C_1-C_6)

que comprende

10 - una primera etapa según el esquema de reacción B-1:

Esquema B-1



15

en el que: $-R^1, R^2, X$ y n son como se definen en la reivindicación 1;

$-R^8$ es un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

20

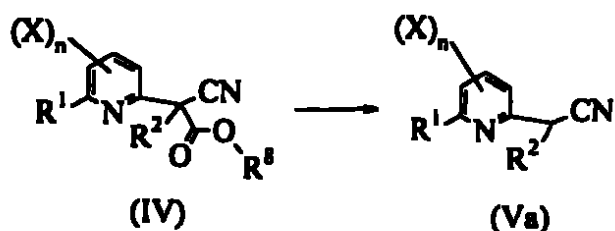
$-U$ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_6)sulfonato;

que comprende la arilación de un derivado de cianoacetato de fórmula general (III) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un derivado de 2-piridilcianoacetato de fórmula general (IV);

25

- una segunda etapa según el esquema de reacción B-2:

Esquema B-2



30

en el que: $-R^1, R^2, X$ y n son como se definen en la reivindicación 1;

$-R^8$ es un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

35

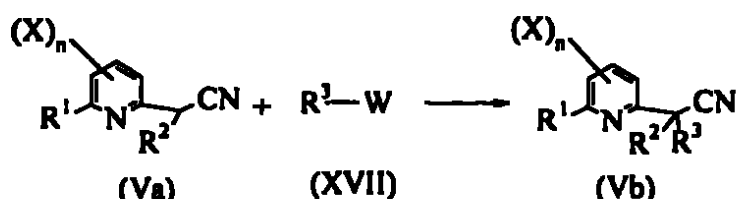
que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento con un

haluro de un compuesto de fórmula general (IV), en el mismo recipiente o en otro para proporcionar, después de calentar a una temperatura de 40°C a reflujo, un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Va);

- una tercera etapa según el esquema de reacción B-3:

5

Esquema B-3



10

en el que: - R¹, R², X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- R³ es un alquilo(C₁-C₈)

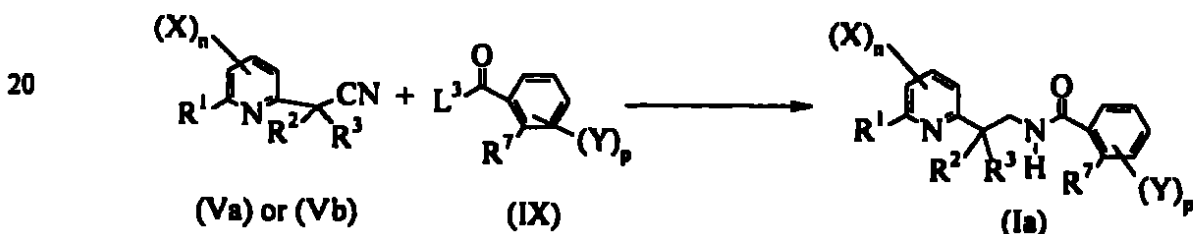
- W es un átomo de halógeno, un alquil(C₁-C₈)sulfonato o un haloalquil(C₁-C₈)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato,

que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (Va) mediante un reactivo de fórmula general (XVII), para proporcionar un compuesto de fórmula general (Vb);

15

- una cuarta etapa según el esquema de reacción B-4:

Esquema B-4



20

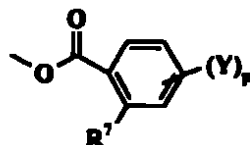
en el que: - R¹, R², R⁷, X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación

25 1;

- R³ es un alquilo(C₁-C₈)

- L³ es un grupo saliente elegido entre un grupo -OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₈), un haloalquilo(C₁-C₈), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; - OCHO, -SCSN(Me)₂ o un grupo de fórmula

30

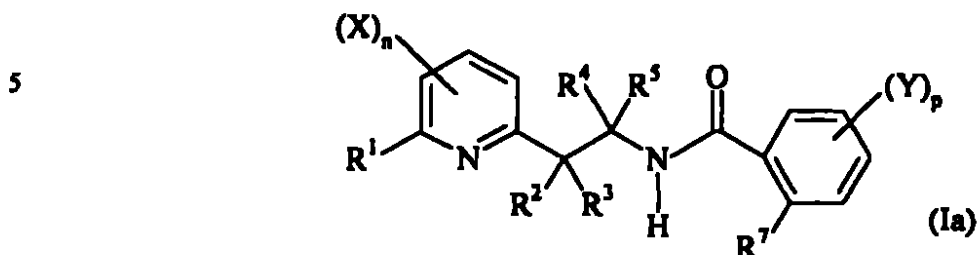


que comprende la reducción, mediante hidrogenación o con un hidruro, de un compuesto de fórmula general (Va) o un compuesto de fórmula general (Vb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (IX),

35

para producir un compuesto de fórmula general (Ia), a una temperatura de 0°C a 150°C y a una presión desde 1 bar a 100 bar;

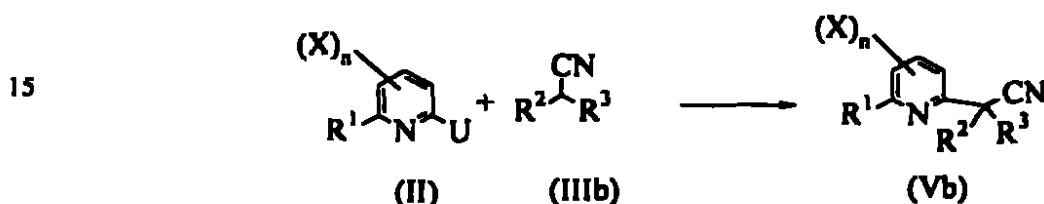
14. Un procedimiento (C) para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia):



10 en el que R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , X , Y , n y p son como se definen en la reivindicación 1; que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción C-1:

Esquema C-1

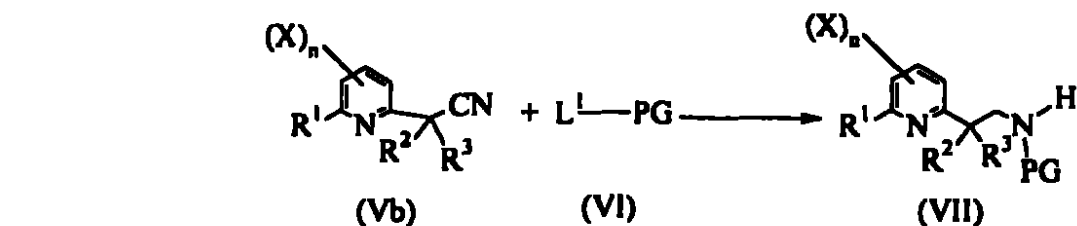


en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

20 - U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_6)sulfonato que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (IIIb) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Vb), en presencia de una base y a una temperatura de -100°C a 200°C;

- una segunda etapa según el esquema de reacción C-2:

Esquema C-2



en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- L^1 es un grupo saliente elegido entre un grupo $-OR^8$ o un grupo $-OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

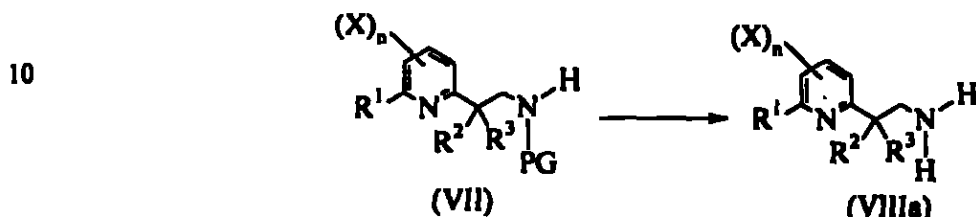
35 - PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -

COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, mediante hidrogenación o mediante un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) ó (Vb), en presencia de un compuesto de fórmula general (VI), para producir un compuesto de fórmula general (VII);

- una tercera etapa según el esquema de reacción C-3:

Esquema C-3



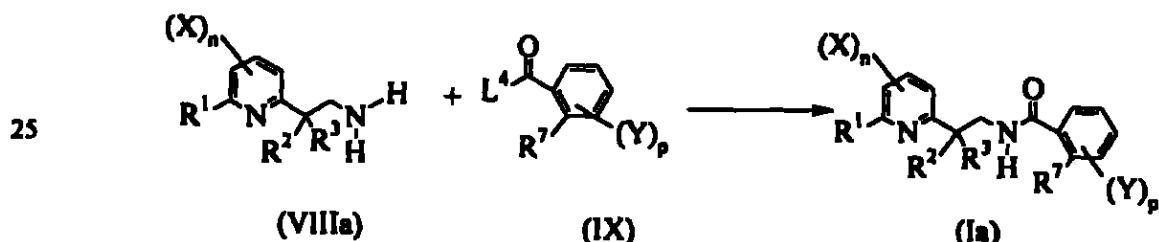
en el que: - R¹, R², R³, X y n son como se definen en la reivindicación 1;

15 - PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁸ o un grupo -COR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o básico, de un compuesto de fórmula general (VII), para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIIa) o una de sus sales;

- una cuarta etapa según el esquema de reacción C-4:

Esquema C-4



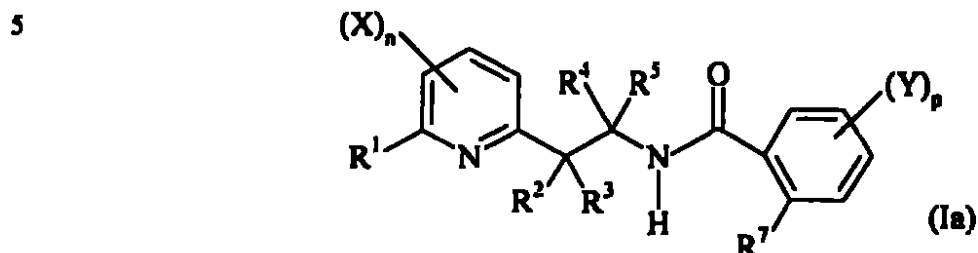
en el que: - R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación 1;

30 - L⁴ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OCHO, -SCSN(Me)₂, un grupo -OR⁸, un grupo OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₆), un haloalquilo(C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula



que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIa) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

15. Un procedimiento (D) para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia):



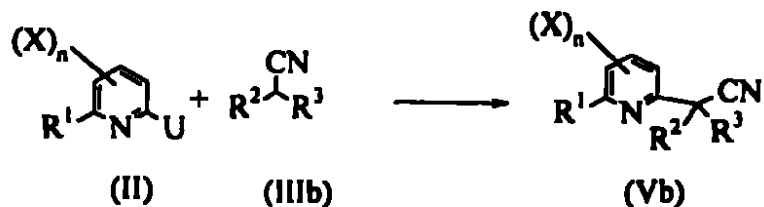
en la que : - R^1 , R^2 , R^7 , X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación

1;

- R^3 es un alquilo(C_1 - C_8) que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción D1:

15 Esquema D-1



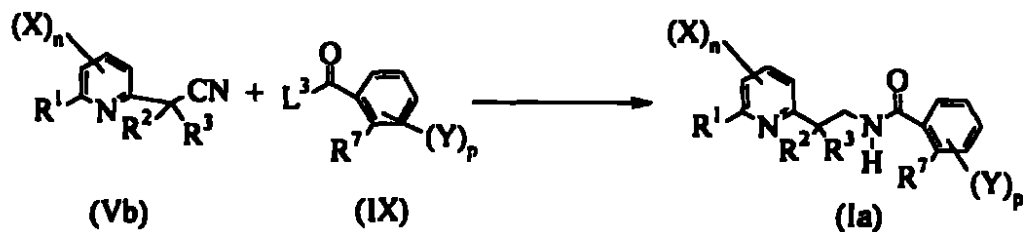
en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1 - C_8)sulfonato o un haloalquil(C_1 - C_8)sulfonato;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (IIIb) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un derivado de 2-piridilacetonitrilo de fórmula general (Vb), en presencia de una base y a una temperatura de -100°C a 200°C ;

- una segunda etapa según el esquema de reacción D-2:

30 Esquema D-2

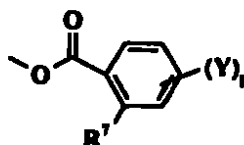


en el que: - R^1 , R^2 , R^7 , X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación

1;

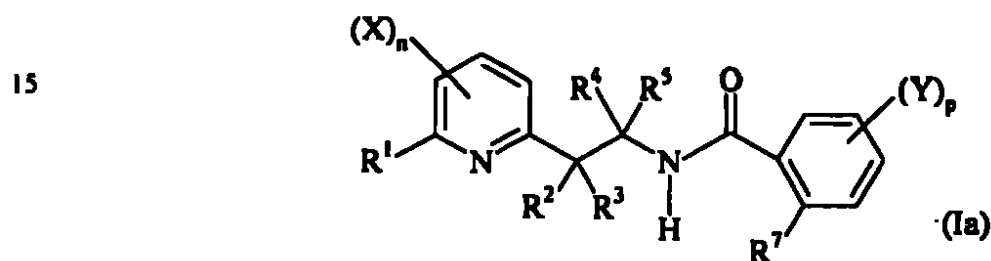
- R^3 es un alquilo(C_1-C_8)

- L^3 es un grupo saliente elegido entre un grupo $-OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; - $OCHO$, $-SCSN(Me)_2$ o un grupo de fórmula



que comprende la reducción mediante hidrogenación o mediante un donante de hidruros, de un compuesto de fórmula general (Va) o un compuesto de fórmula general (Vb), en presencia de un compuesto de fórmula general (IX), para producir un compuesto de fórmula general (Ia);

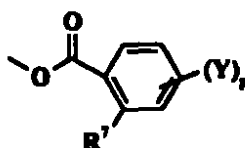
16. Un procedimiento (E) para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia):



en la que : - R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , X , Y , n y p son como se definen en la reivindicación 1;

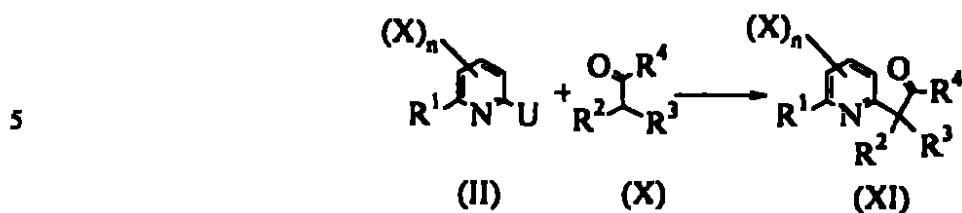
- R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o un haloalquilo(C_1-C_8);

- R^5 es un alquilo(C_1-C_8) o un haloalquilo (C_1-C_8); - L^4 es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula



que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción E-1:

Esquema E-1

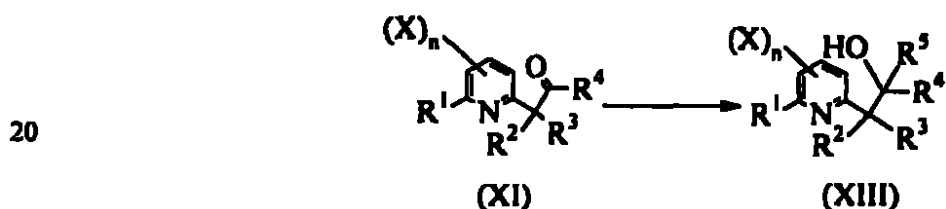
en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo($\text{C}_1\text{-C}_8$) o un haloalquilo($\text{C}_1\text{-C}_8$);

- U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil($\text{C}_1\text{-C}_8$)sulfonato o un haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_8$)sulfonato;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (X) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XI);

- una segunda etapa según el esquema de reacción E-2:

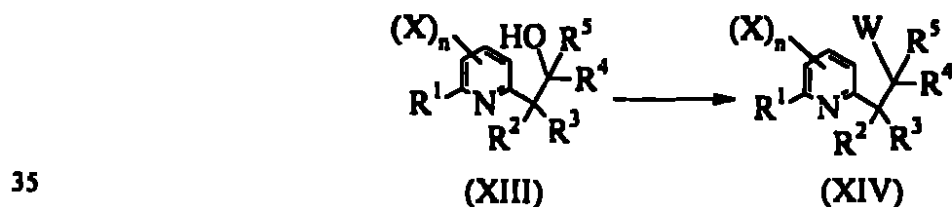
Esquema E-2

en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo($\text{C}_1\text{-C}_8$) o un haloalquilo($\text{C}_1\text{-C}_8$);

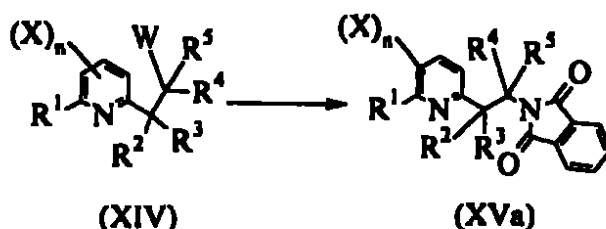
que comprende la conversión de un compuesto de fórmula general (XI) en un compuesto de fórmula general (XIII) mediante adición de un compuesto de fórmula general $\text{R}^5\text{-M}$, en la que R^5 es un alquilo($\text{C}_1\text{-C}_8$) o un haloalquilo($\text{C}_1\text{-C}_8$) y M es una especie metálica;

- una tercera etapa según el esquema de reacción E-3:

Esquema E-3

- en el que:
- R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);
 - R^5 es un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo (C_1-C_6);
 - W es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_6)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato;
- que comprende la activación de un compuesto de fórmula general (XIII) convirtiéndolo en un compuesto de fórmula general (XIV);
- una cuarta etapa según el esquema de reacción E-4:

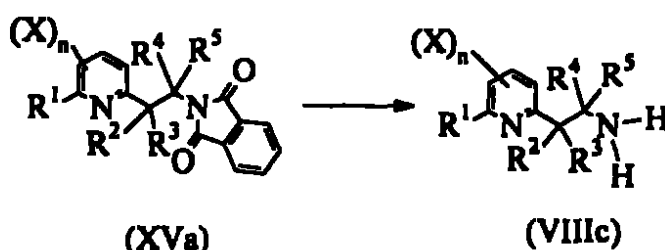
Esquema E-4



- en el que:
- R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);
 - R^5 es un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo (C_1-C_6);
 - W es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_6)sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato;
- que comprende la sustitución de un compuesto de fórmula general (XIV) con un derivado de ftalamida o una de sus sales para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVa);

- una quinta etapa según el esquema de reacción E-5:

Esquema E-5

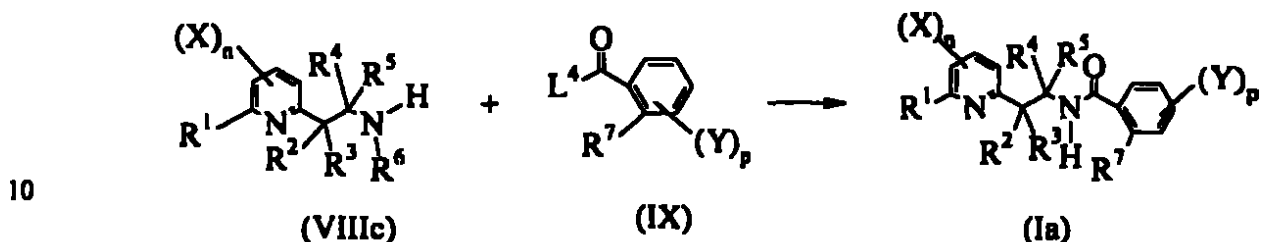


- en el que:
- R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);
 - R^5 es un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo (C_1-C_6);

que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (XVa), haciéndolo reaccionar con un hidrato de hidrazina o una sal de hidrazina, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIIc) o una de sus sales;

- una sexta etapa según el esquema de reacción E-6:

5 Esquema E-6

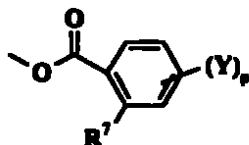


en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación 1;

15 - R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);

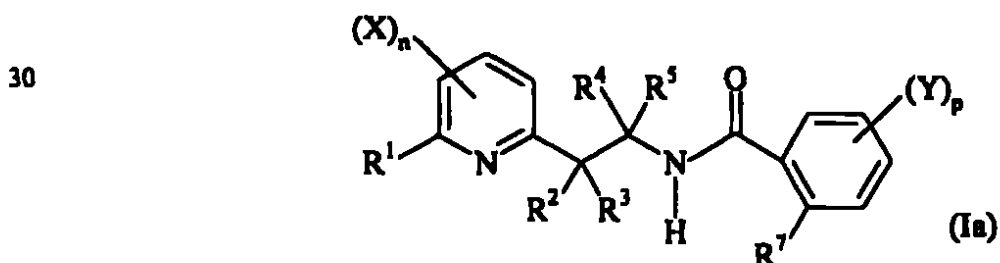
- R^5 es un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo (C_1-C_6); - L^4 es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OCHO, -SCSN(Me)₂, un grupo -OR⁸, un grupo OCOR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C_1-C_6), un haloalquilo(C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula

20



25 que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIb) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

17. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia):



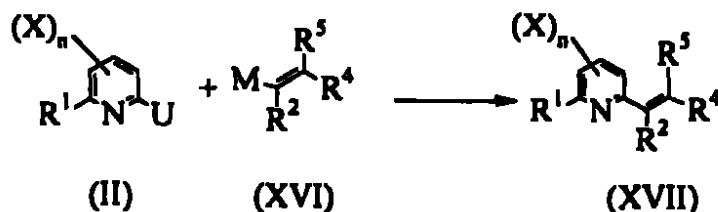
35 en la que: - R^1 , R^7 , X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación 1;

- R^2 , R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);

que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción F-1:

Esquema F-1



en el que: - R^1 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil(C_1-C_8)sulfonato o un haloalquil(C_1-C_8)sulfonato;

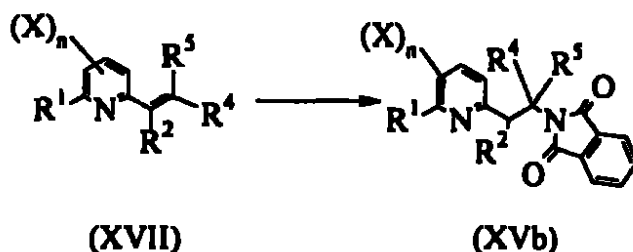
- R^2 , R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);

- M es una especie metálica o metaloide;

que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de piridina de fórmula general (II) con una especie vinílica de fórmula general (XVI), a una temperatura de 0°C a 200°C, para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVII);

- una segunda etapa según el esquema de reacción F-2:

Esquema F-2



en el que: - R^1 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;

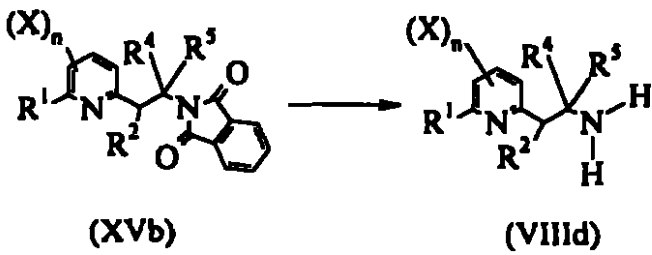
- R^2 , R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);

que comprende la adición de italamida o una de sus sales sobre un compuesto de fórmula general (XVII), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVb);

- una tercera etapa según el esquema de reacción F-3:

Esquema F-3

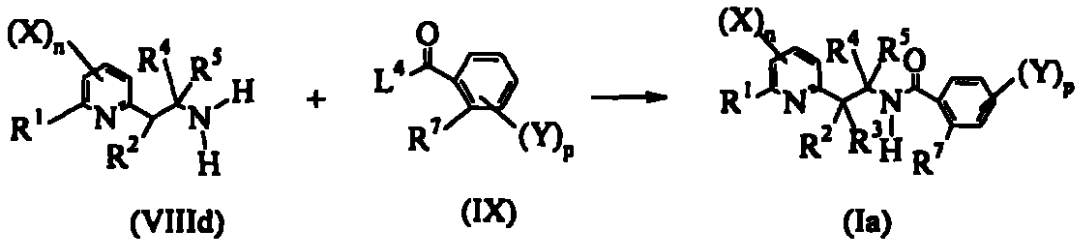
5



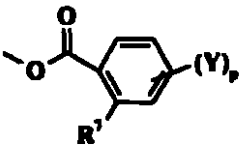
- 10 en el que: - R^1 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^2 , R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);
que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (XVb) con un hidrato de hidrazina o una sal de hidrazina, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIId) o una de sus sales;
15 - una cuarta etapa según el esquema de reacción F-4:

Esquema F-4

20



- 25 en el que: - R^1 , R^7 , X , Y , n y p son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^2 , R^4 y R^5 se eligen independientemente uno del otro entre un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o haloalquilo(C_1-C_8);
 - L^4 es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OCHO$, $-SCSN(Me)_2$, un grupo $-OR^8$, un grupo $OCOR^8$, siendo R^8 un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula
30

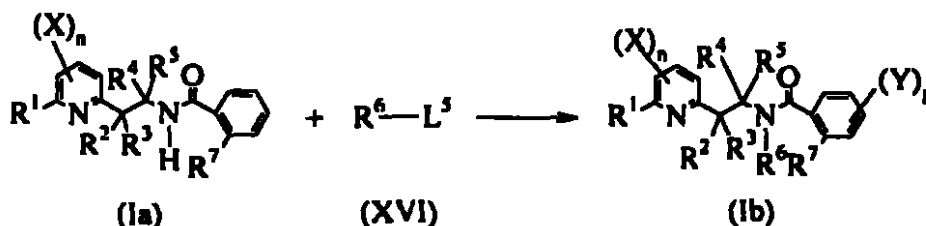


- 35 que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula

general (VIIIb) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (Ia).

18. Un procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 12 a 17, que comprende adicionalmente una etapa de acuerdo al esquema de reacción G:

Esquema G



en el que: - $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, X, Y, n$ y p son como se definen en la reivindicación 1;

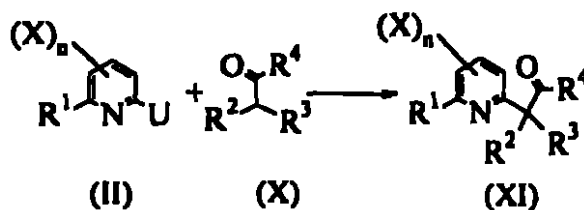
- L^5 es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, 4-metil fenilsulfonilo, metilsulfonilo;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ia) con un compuesto de fórmula general (XVI), para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ib);

19. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se define en la reivindicación 1, que comprende

- una primera etapa según el esquema de reacción H-1:

Esquema H-1



en el que: - R^1, R^2, R^3, X y n son como se definen en la reivindicación 1;

- R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_6) o un haloalquilo(C_1-C_6);

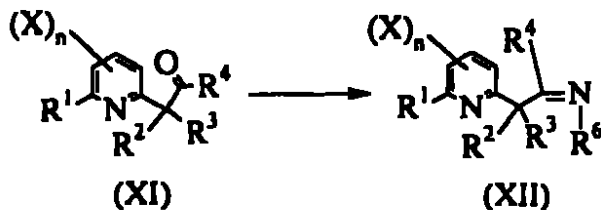
- U es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquilo(C_1-C_6)sulfonato o un haloalquilo(C_1-C_6)sulfonato;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (X) con un derivado de piridina de fórmula general (II), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XI), en presencia de una base y a una temperatura de $0^\circ C$ a $200^\circ C$;

- una segunda etapa según el esquema de reacción H-2:

Esquema H-2

5



10

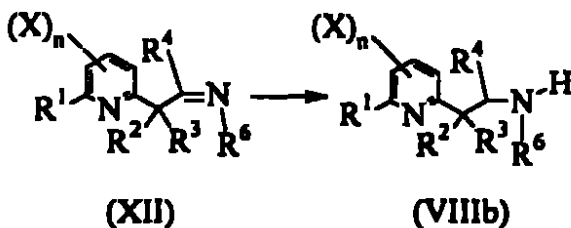
en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o un haloalquilo(C_1-C_8);

15

- R^6 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un alcoxi(C_1-C_6) o un cicloalquilo(C_3-C_7);
 que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (XI) con una amina de fórmula R^6-NH_2 , para proporcionar un derivado de imina de fórmula general (XII);
 - una tercera etapa según el esquema H-3:

Esquema H-3

20



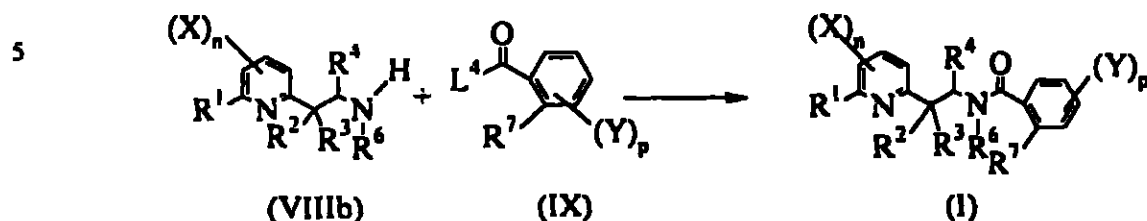
25

en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , X y n son como se definen en la reivindicación 1;
 - R^4 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8) o un haloalquilo(C_1-C_8);

30

- R^6 es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C_1-C_8), un haloalquilo(C_1-C_8), un alcoxi(C_1-C_6) o un cicloalquilo(C_3-C_7);
 que comprende la reducción de un derivado de amina de fórmula general (XII) mediante hidrogenación o un donante de hidruros, en el mismo o diferente recipiente, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (VIIIb) o una de sus sales;
 - una cuarta etapa según el esquema de reacción H-4:

35

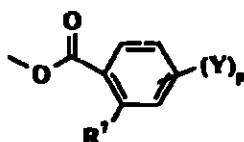
Esquema H-4

10 en el que: - R¹, R², R³, R⁷, X, Y, n y p son como se definen en la reivindicación 1;

- R⁴ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈) o un haloalquilo(C₁-C₈);

15 - R⁶ es un átomo de hidrógeno, un alquilo(C₁-C₈), un haloalquilo(C₁-C₈), un alcoxi(C₁-C₃) o un cicloalquilo(C₃-C₇);

- L⁴ es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OCHO, -SCSN(Me)₂, un grupo -OR⁸, un grupo OCCR⁸, siendo R⁸ un alquilo(C₁-C₈), un haloalquilo(C₁-C₈), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo; o un grupo de fórmula



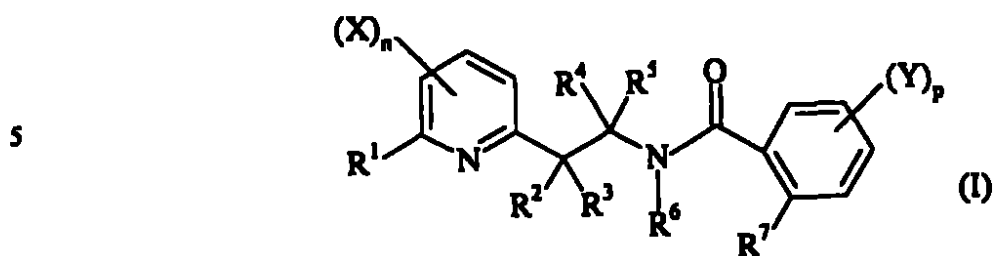
25 que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de amina de fórmula general (VIIIb) o una de sus sales, con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (IX), para proporcionar compuesto de fórmula general (I).

20. Composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto según la reivindicación 1 y un soporte aceptable en el sector agrícola.

21. Método para luchar de forma preventiva o curativa contra los hongos fitopatogénicos de cultivos agrícolas, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición según la reivindicación 20 a las semillas de las plantas o a las hojas de las plantas, y/o a los frutos de las plantas o al suelo en el que las plantas crecen o en el que se desea que crezcan.

RESUMEN

Un compuesto de fórmula general (I):



Procedimiento para preparar este compuesto.

Composición fungicida que comprende un compuesto de fórmula general (I).

- 10 Método para tratar plantas mediante aplicación de un compuesto de fórmula general (I) o una composición que lo comprende.

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR DARREN
MANSFIELD A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 22 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sr. Darren MANSFIELD quien firma este documento.
Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. **República Francesa**
Este documento público
2. **Ha sido firmado por Patrice GAREL**
3. **Quien actúa en calidad de Notario**
4. **lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)**

CERTIFICADO

5. **en Lyon**
6. **el 5/1/06**
7. **por el Procurador de la Corte de Apelaciones**
8. **Bajo el No. 101**
9. **Sello/Estampilla**
10. **Firma: El Procurador General**

GABRIEL RUEDA CHANDIO
Traductor e Intérprete Oficial
Res. 2000 de 1997 del Min. de Justicia
Min. de Relaciones Exteriores

ASSIGNMENT

Darren MANSFIELD
25 montée Bonafous F-69004 Lyon
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA

A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:
New 2-Pyridinylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

LYON 22-12-2005

D.S. Mansfield
Place, date and signature

CESION

Darren MANSFIELD
25 montée Bonafous F-69004 Lyon
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

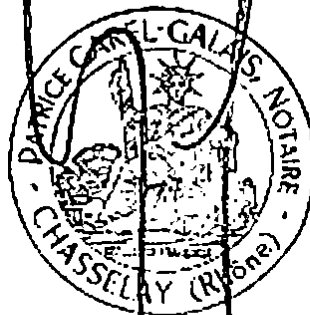
(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M. GAREL-GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
MR Darren MANSFIELD
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06



APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française **COLOMBIE**

Le présent acte public

2. a été signé par Patrice GARTEL

3. agissant en qualité de Notaire

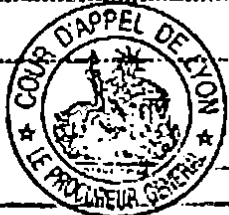
4. est revêtu du sceuililindre de son étude à
Chapelauy (68)
A. 1916

5. à Lyon

6. le 31/1/06

7. par la Procureur général près la Cour d'Appel de Lyon

8. sous n° 101

9. Sceau 

10. Signature 

"L'Acte est revêtu de son sceuililindre et de sa signature. On en va ou
être s'en va l'acte. Et ne s'en va pas l'acte d'acte est
correct ce que la République française en son honneur."

000157
156

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR PIERRE-YVES
COQUERON A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 19 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sr. Pierre-Yves COQUERON quien firma este documento. Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. **República Francesa**
Este documento público
2. **Ha sido firmado por Patrice GAREL**
3. **Quien actúa en calidad de Notario**
4. **lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)**

CERTIFICADO

5. **en Lyon**
6. **el 5/1/06 .**
7. **por el Procurador de la Corte de Apelaciones**
8. **Bajo el No. 106**
9. **Sello/Estampilla**
10. **Firma: El Procurador General**

GABRIEL RUEDA MADRID
Traductor e Interpreté Oficial
Acta. 2000 de 1997 del Min. de Justicia
Acta. de Notarios Externos

ASSIGNMENT

Pierre-Yves COQUERON
36 rue de la Tête d'Or F-69006 Lyon
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA

A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:

**New 2-pyridinylethylbenzamide
compounds.**

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

CESION

Pierre-Yves COQUERON
36 rue de la Tête d'Or F-69006 Lyon
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

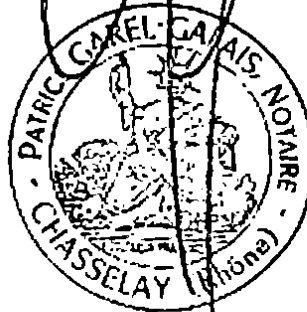
**Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.**

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lyon 13 Dec 2005
Place, date and signature

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M. **GAREL-GALAIS**
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
MR Pierre-Yves COQUERON
qui a été apposée
Chasselay, le 05/12/06



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française

Le présent acte public

COLOMBIE

2. a été signé par

Patrice GAREL

3. agissant en qualité de

Notaire

4. est revêtu du sceuil/nbre de

au étude à

Chazelay (69)

A été

5. à

Lyon

6. le

5/1/06

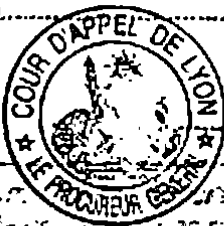
7. par le Procureur général près le

Cour d'appel de Lyon

8. sous n°

106

9. Sceau



10. Signature

"L'Apostille mentionne celui qui a signé l'acte public, du greffier ou du notaire, sans mentionner le nom de la personne qui a apposé l'apostille. Elle ne peut être apposée que si la signature ou le sceuil/nbre est correct ou que la République française a appliqué son contrôle."

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR Philippe
DESBORDES A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 19 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sr. Philippe DESBORDES quien firma este documento. Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. **República Francesa**
Este documento público
2. **Ha sido firmado por Patrice GAREL**
3. **Quien actúa en calidad de Notario**
4. **lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)**

CERTIFICADO

5. **en Lyon**
6. **el 5/1/06**
7. **por el Procurador de la Corte de Apelaciones**
8. **Bajo el No. 103**
9. **Sello/Estampilla**
10. **Firma: El Procurador General**


GABRIEL RUEDA CHADID
Traductor e Interpreté Oficial
Dec. 2000 de 1999 del Min. de Justicia
Min. de Relaciones Exteriores

ASSIGNMENT

Philippe DESBORDES
30 rue Bancel F-69007 Lyon
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA

A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009,
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:

New 2-pyridinylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

15 Dec. 2003 Lyon



Place, date and signature

CESION

Philippe DESBORDES
30 rue Bancel F-69007 Lyon
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

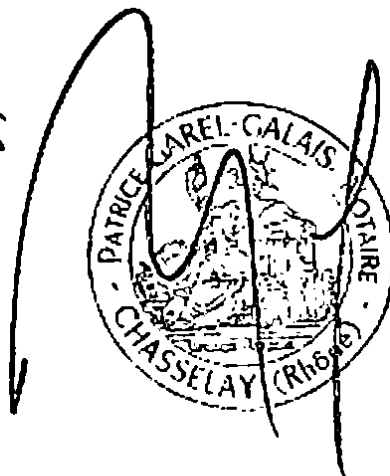
(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M^r **GAREL-GALAIS**
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
Mr **Philippe DESBORDES**
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06



APPEL
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française

Le présent acte a été fait à **Colombie**

2. a été signé par **Patrice GAREL**

3. agissant en qualité de **Notaire**

4. est revêtu du sceau d'origine de **son étude à**
Chenelay (69)

5. à **Lyon**

6. n° **511106**

7. par le Procureur général près la Cour d'appel de **Lyon**

8. sous n° **103**

9. Sceau :

10. Signature :



"L'acte est conforme au contenu du document, en vertu de la signature, du sceau ou
toute autre preuve de son authenticité, et le contenu du document est
correct ou que la République française approuve son contenu."

000168
160

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR HEIKO RIECK
A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 21 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sr. Heiko RIECK quien firma este documento.
Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. República Francesa
Este documento público
2. Ha sido firmado por Patrice GAREL
3. Quien actúa en calidad de Notario
4. lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)

CERTIFICADO

5. en Lyon
6. el 5/1/06
7. por el Procurador de la Corte de Apelaciones
8. Bajo el No. 107
9. Sello/Estampilla
10. Firma: El Procurador General

GABRIEL RUEDA CHADID
Traductor e Interpreté Oficial
Res. 8295 de 1997 del M. de Justicia
M. de Relaciones Exteriores

ASSIGNMENT

Heiko RIECK
9 rue Claude Monet F-69110 Sainte-
Foy-lès-Lyon
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA
A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:
New 2-pyridynylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

H. Rieck
Lyon 21-12-2005
Place, date and signature

CESION

Heiko RIECK
9 rue Claude Monet F-69110 Sainte-
Foy-lès-Lyon
por medio de la presente cedo (cedemos) a
Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

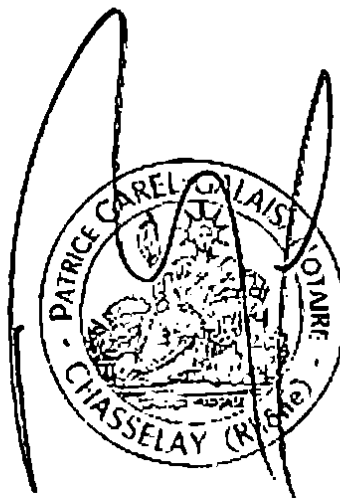
(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M. **GAREL-GALAIS**
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
MR **Heiko RIECK**
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06.



APPROBATION
(Convention de La Haye du 5 octobre 1951)

1. République française COLOMBIE

Le présent acte public

2. a été signé par..... Patrice GAREL

3. agissant en qualité de..... Notaire

4. est revêtu du sceau de la Cour d'appel de..... son étude à
Chamelay (69)
 A. 1510

5 à..... Lyon

6 le..... 5.1.106

7 par le Procureur général près la Cour d'appel de..... e Lyon

8. sous n°..... 102

9. Sceau.....

10. Signature.....



"L'Approbation contient le sceau de la République, du sceau ou timbre de la Cour d'appel, et le contenu du document est correct ou que la République française approuve son contenu."

000186

162

LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR Marie-Claire GROSJEAN-COURNOYER A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 22 DE DICIEMBRE DE 2005.

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sra. Marie-Claire GROSJEAN-COURNOYER quien firma este documento. Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. **República Francesa**
Este documento público
2. **Ha sido firmado por Patrice GAREL**
3. **Quien actúa en calidad de Notario**
4. **lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)**

CERTIFICADO

5. **en Lyon**
6. **el 5/1/06**
7. **por el Procurador de la Corte de Apelaciones**
8. **Bajo el No. 102**
9. **Sello/Estampilla**
10. **Firma: El Procurador General**

GABRIEL RUEDA CHADID
Traductor e Interpreté Oficial
Pase. 0000 de 1987 del Mto. de Justicia
Mto. de Traducción y Escritura

ASSIGNMENT

Marie-Claire GROSJEAN-COURNOYER
Le Trève Collonge, route d'Albigny
F-69250 Curis au Mont d'Or
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA

A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:
New 2-Pyridinylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

LYON
22/12/05
Place, date and signature

Je soussigné M. GAREL GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
Mme Marie-Claire GROSJEAN-COURNOYER
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06.

CESION

Marie-Claire GROSJEAN-COURNOYER
Le Trève Collonge, route d'Albigny
F-69250 Curis au Mont d'Or
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

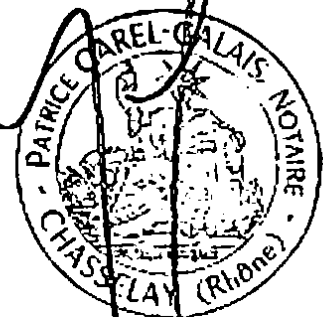
domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lugar, fecha y firma

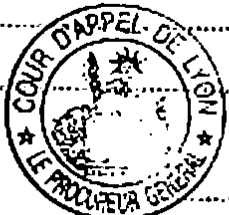
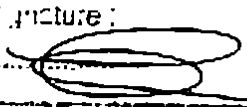


APPEL
(Convention de l'Union du 5 octobre 1951)

1. République Française Colombie
Le représentant public

2. a été représenté par Patrice GAREL
3. agissant en qualité de Notaire
4. est ressortissant du ressort de non élude à
Chasselay (69)
5. à Lyon
6. n° 511106
7. par la Procureur général près la Cour d'appel de Lyon

8. sous n° 102
9. Signé :

 10. Signature : 

"L'Etat français ne reconnaît pas l'existence d'un droit de propriété ou
d'un droit de possession sur les biens situés en territoire étranger. Le document est
correct et ne peut qu'être considéré comme tel." "

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR PIERRE GENIX
A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 19 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sr. Pierre GENIX quien firma este documento.
Chassélay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. **República Francesa**
Este documento público
2. **Ha sido firmado por Patrice GAREL**
3. **Quien actúa en calidad de Notario**
4. **lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)**

CERTIFICADO

5. **en Lyon**
6. **el 5/1/06**
7. **por el Procurador de la Corte de Apelaciones**
8. **Bajo el No. 104**
9. **Sello/Estampilla**
10. **Firma: El Procurador General**

GABRIEL RUEDA CHADID
Traductor e Interpreté Oficial
Pase. 2000 de 1997 del Min. de Justicia
Min. de Relaciones Exteriores

165 B

ASSIGNMENT

Pierre GENIX
14 rue Duviard F-69004 Lyon
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA

A French Corporation
organized under the laws of
France

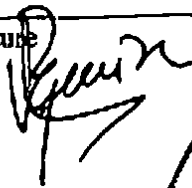
Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:
New 2-Pyridinylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

Lyon le 19.12.2005

Place, date and signature


CESION

Pierre GENIX
14 rue Duviard F-69004 Lyon
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

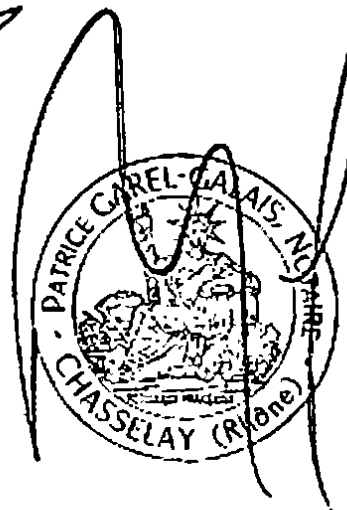
(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletibenzamida.

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M^e GAREL-GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
Mr Pierre GENIX
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française

COLOMBIE

Le présent acte public

2. a été signé par... Patrice GAREL

3. agissant en qualité de... Notaire

4. est revêtu du sceau/nombre de... son étude à

Chazelay (69)

A ...

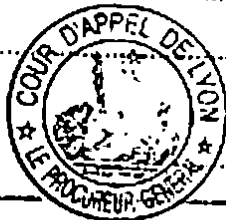
5 à... Lyon

6. le... 5/1/06

7. par le Procureur général près la Cour d'appel d'e... Lyon

8. sous n°... 104

9. Sceau.



10. Signature

*L'apostille certifie seulement l'authenticité de la signature, du sceau ou du timbre sur la base duquel elle est apposée, et que la copie du document est correcte ou que la République française approuve son contenu."

0000172
166

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR ALLAIN
VYLLIER A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 20 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sr. Alain VYLLIER quien firma este documento.
Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. República Francesa
Este documento público
2. Ha sido firmado por Patrice GAREL
3. Quien actúa en calidad de Notario
4. lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)

CERTIFICADO

5. en Lyon
6. el 5/1/06
7. por el Procurador de la Corte de Apelaciones
8. Bajo el No. 105
9. Sello/Estampilla
10. Firma: El Procurador General


GABRIEL RUEDA CHADID
Traductor e Interpreté Oficial
Res. 2000 de 1997 del Min. de Justicia
Min. de Relaciones Exteriores

167

ASSIGNMENT

Alain VILLIER
3 chemin des Garennes F-69450 Saint
Cyr au Mont d'Or
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA
A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:

New 2-pyridinylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

Place, date and signature

Je soussigné M. GAREL-GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
Mr Alain VILLIER
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06

CESION

Alain VILLIER
3 chemin des Garennes F-69450 Saint
Cyr au Mont d'Or
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

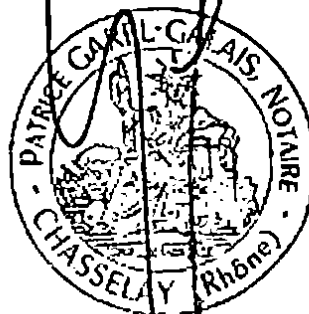
domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.

en lo que concierne a la República de
Colombia.

Lugar, fecha y firma



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française

COLOMBIE

Le présent acte public

2. a été signé par... Patrick GARDEL

3. agissant en qualité de... Notaire

4. est revêtu du sceau/timbre de... son étude à

Chasselay (69)

Arrêté

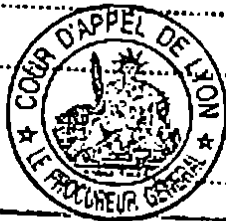
5. à Lyon

6. le 5/11/06

7. par le Procureur général près la Cour d'appel de Lyon

8. sous n° 105

9. Sceau.



10. Signature :

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

**LEGALIZACIÓN DEL DOCUMENTO CESIÓN OTORGADO POR ISABELLE
CHRISTIAN A BAYER CROPS SCIENCE SA, EL 29 DE DICIEMBRE DE 2005.**

- El suscrito Sr. Garel Galais, Notario de Chasselay (Rhône) Certifica verdadera la firma del Sra. Isabelle CHRISTIAN quien firma este documento. Chasselay, el 05/01/06.

**APOSTILLE
Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
COLOMBIA**

1. **República Francesa**
Este documento público
2. **Ha sido firmado por Patrice GAREL**
3. **Quien actúa en calidad de Notario**
4. **lleva el sello/estampilla del Notario en Chasselay (69)**

CERTIFICADO

5. **en Lyon**
6. **el 5/1/06**
7. **por el Procurador de la Corte de Apelaciones**
8. **Bajo el No. 100**
9. **Sello/Estampilla**
10. **Firma: El Procurador General**


GABRIEL RUEDA CHADID
Traductor e Interpreté Oficial
Pon. 6000 de 1987 del Min. de Justicia
Min. de Relaciones Exteriores

ASSIGNMENT

Isabelle CHRISTIAN -
46 rue Saint Jean F-69005 Lyon
by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience SA

A French Corporation
organized under the laws of
France

Domiciled in
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(hereinafter referred to as the
"ASSIGNEE"),
all my (our) rights, title and interest in
and to my (our) invention for a new and
useful improvement entitled and as
fully set forth and described in:
New 2-Pyridinylethylbenzamide
compounds.

So far as the Republic of Colombia is
concerned.

CESION

Isabelle CHRISTIAN
46 rue Saint Jean F-69005 Lyon
por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer CropScience SA

una Sociedad Francesa organizada bajo
las leyes de
Francia

domiciliada en
16 rue Jean-Marie Leclair F-69009
Lyon

(de ahora en adelante el
"CESIONARIO"),
todos mis (nuestros) derechos, título e
interés sobre mi (nuestra) invención tal
como describe en:

Nuevos compuestos
2-piridiniletilbenzamida.

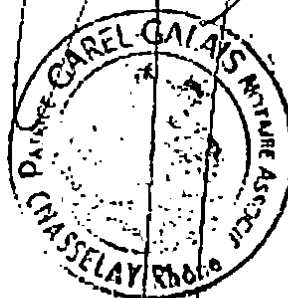
en lo que concierne a la República de
Colombia.

Place, date and signature

Cher 29/12/05
à Lyon

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M^o GAREL GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
M^{me} Isabelle CHRISTIAN
qui a été apposée
Chasselay, le 05/01/06



APC STILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française Colombie

Le présent acte public

2. a été signé par Patrice GAREL

3. agissant en sa qualité de Notaire

4. est revêtu de l'authenticité de son étude à
Chasselay (69)

5. a signé

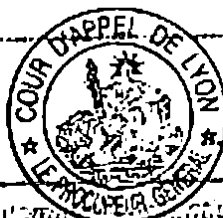
6. le 5.1.106

7. par le Procureur général près le Cour d'appel de Lyon

8. sous n° 100

9. Sceau

10. Signature :



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

Relativo folios del 178 al 182

- Extracto

- Torjetas



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 0600222 0000000 Folios: 182
Fecha (AMD): 2006-01-30 16:55:47
Trámite : 011 PCT-PATENT 378 FASE NACI 411 PRESENTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Delegatura de Propiedad Industrial División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

PATENTE DE INVENCION (✓)	MODELO DE UTILIDAD ()	USUARIO (✓)	RADICADOR ()
-Indicación de que se solicita la concesión de una patente.		(✓)	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.		(✓)	()
-Descripción de la invención.		(✓)	()
-Dibujos de ser estos pertinentes.		(✓)	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.		(✓)	()
COMPLETA (✓)	INCOMPLETA ()	()	()

DISEÑO INDUSTRIAL ()

-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se 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 ()

-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
-Representación gráfica del Esquema Trazado.	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()

Firma Responsable:

Fecha:


Bogotá, Enero 30 de 2006

172

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 184

2020
Bogotá D.C.,

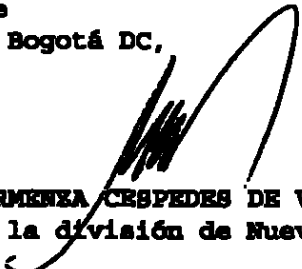
Doctor(a)
CORREA ORDOÑEZ ALVARO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPS SCIENCE S.A.

REFERENCIA	Radicación No.	06 8282
	Solicitud internacional	EP2004/009145
	Fecha inicio fase nacional	27/02/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	361
	Folios	1

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

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

11 ABR. 2006


ALIX CARMONA CESPÉDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpall