

88



Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-95699

21 EXPEDIENTE No

54 TÍTULO “DERIVADOS DE 2-PIRINIDILETILCARBOXAMIDA
Y SU USO COMO FUNGICIDAS”

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C07D 409/12

71 SOLICITANTE BAYER CROSCIENCE SA

DOMICILIO LYON, FRANCIA

74 APODERADO ALVARO CORREA ORODNEZ
TP 20 281

22 BOGOTÁ, D C, SEPTIEMBRE 22, 2006

Cesión
por 03 10 2006

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 06-095699- 00000-0000

Fee: 2008-09-22 15:41:26 Dep. 2020 NUECREACIONE

Tra. 11 PATENTENYH

Eve: 378 FASENACIONALI

Act 411 PRESENTACION

Folios: 124

adicación

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

①

SOLICITUD DE :

☒ X

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒ X

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

②

SOLICITANTE
(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE S.A.

Dirección: 16 rue Jean-Marie Leclair, F-69008 Lyon, Francia

Nacionalidad o Domicilio: Lyon, Francia

Lugar de Constitución:

Teléfono:

Fax:

E-Mail:

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No.10-62 Piso 6

Teléfono: 634 1500

Fax: 376 2211

E-Mail: office.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒ X

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

79.143.366 de

Número

Umaguén

TP 20.281

④

INVENTOR (ES)
(72)

Nombre: MANSFIELD, Darren James; RIECK, Helko; COQUERON, Pierre-Yves; DESBORDES, Philippe; GROSJEAN-Courmoyer, Marie-Claire; GENIX, Pierre y VILLIER, Alain

Dirección: 25 montée Bonafous, F-69004 Lyon (FR); 9 rue Claude Monet, F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon (FR); 38 rue de la Tête d'Or, F-69008 Lyon (FR); 30 rue Bancel, F-69007 Lyon (FR); Le Tréve Collonge, Route d'Albigny, F-69250 Curis au mont d'or (FR); 14 rue Duviard, F-69004 Lyon (FR) y 3 chemin des Garannes, F-69450 Saint Cyr au Mont d'or (FR)

Nacionalidad o Domicilio: Británica, Alemania, Francesa, Francesa, Francesa, Francesa, Francesa y Francesa, respectivamente

⑤

PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/003282

Fecha 01/03/2005

Publicación Internacional No. WO 2005/085238

Fecha 15/09/2005

⑥

Título (84)

DERIVADOS DE 2-PIRIDINILETILCARBOXAMIDA Y SU USO COMO FUNGICIDAS

⑦

Clasificación Internacional (81)

C07D 409/12

⑧

Prioridad

SI

☒ X

NO

☐

(33) País de Origen

EP

(32) Fecha

03/03/2004

(31) Número de Solicitud

04356029.1

⑨

Comprobante de pago No. 8-64862

Fecha 24-AGO-2008

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

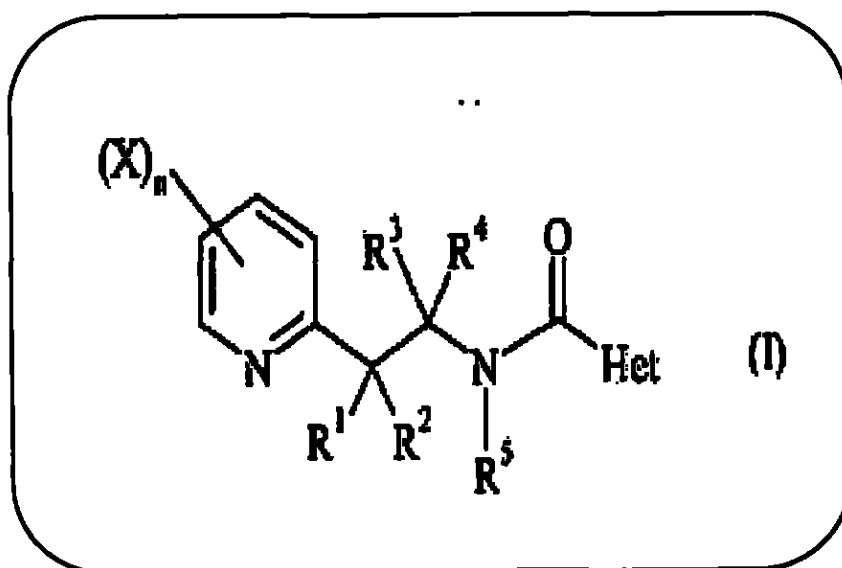
10

ANEXOS

00002

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

11 FIGURA CARACTERISTICA



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

FIRMA: [Signature]

C.C. 79.143.366 de Uniquén R.P. 20.281

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

L 518

00003

SECCION DE REGISTRO DE INDUSTRIAS Y COMERCIO
Rad: 06-095698-00000-0000
Fee: 2008-09-22 15:41:26 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTE/II
Eve: 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios: 124

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

OFICIAL DE CAJA : 06 - 64,862
FECHA : AGOSTO 24 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PASO	BANCO	CUENTA	No. PASO	FECHA PGO	Vr. PASO
BECK LARA RODRIGUEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	49367693	24/08/2006	65,767,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
		TOTAL :	\$ 463,000.00

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

POD-02638

Traducción oficial del francés por Marlén 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 Galaia, 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 Galaia. Notario de Chasselay- Ródano (firma).

Al reverso:

APOSTILLA

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

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

CERTIFICADO

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

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

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

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

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

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

APOSTILLA

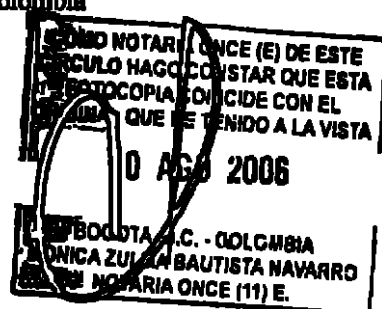
(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)- Colombia

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

CERTIFICADO

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

Es traducción conforme con copia para confrontar- 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

BANKER & MCKINNEY

Raisbeck, Lara, Rodriguez & Rueda
Av. 82 No. 10 - 82 Piso 8
Bogotá, Colombia

NTT: 880.088.840-3
Tel: +57 1 634 1800
Fax: +57 1 378 2211
www.bakernet.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 - 82, 8th floor, of Bogotá D. C., Colombia, a full and sufficient power of attorney to obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models, industrial designs, integrated circuits, layout-designs and vegetal varieties; the registration of trademarks, denominations of origin, commercial names, trade emblems, slogans and domain names; its renewal, assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Processes of protection to the consumer, unfair competition, oppositions, cancellations, nullity, precautionary injunctions, infringement, granting of licenses, writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, an administrative processes relating to those rights. And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

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

Done and subscribed in
Lyon

On the _____ day of
February 11th, 2005

Alexander NOWAK



PODER

La abajo firmada,

BAYER CROPSCIENCE SA

domiciliada en

18, 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 - 82 Piso 8 en Bogotá D. C., Colombia, poder especial amplio y suficiente, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera autoridades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, esquemas de trazado de circuitos integrados y variedades vegetales; el registro de marcas, denominaciones de origen, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales y nombres de dominio; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Los procesos para la protección del consumidor, competencia desleal, oposiciones, cancelaciones, nulidades, medidas cautelares, infracciones, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general procesos civiles, penales, administrativos relacionados con estos derechos. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del caso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiales.

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

COMO NOTARIO DE BOGOTÁ
CIRCULO HAGO CONSTAR QUE ESTA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL
ORIGINAL QUE HE VISTO A LA VISTA

10 AGO 2005

BOGOTÁ - COLOMBIA
NICOLA ZULY BAUTISTA NAVARRO
SECRETARIO

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

Lyon



MINISTRE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Claude

1. — République Française

Le présent acte public

2. — a été fait par *GAZEL GAZAIS, Notaire*

3. — en vertu de son pouvoir spécial

4. — en présence de *CHASSEY (69)*

5. — a été fait en vertu de son pouvoir spécial

6. — a été fait en vertu de son pouvoir spécial

7. — a été fait en vertu de son pouvoir spécial

8. — a été fait en vertu de son pouvoir spécial

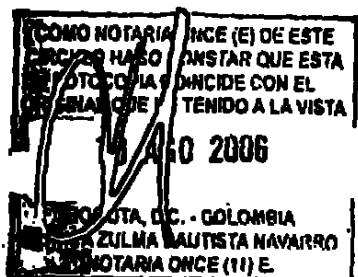
9. — a été fait en vertu de son pouvoir spécial

10. — Signature



10. — Signature

[Signature]



NOTARIAL CERTIFICATION

2

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

CERTIFIES

Alexander NOWAK

1. That _____
of legal age and domiciled in Neunhause Weg 10,
51467 Bergisch Gladbach, Germany
set his hand on the foregoing document.

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

3. That the grantor has executed the foregoing document as
Authorized Representative

of the judicial person Bayer CropScience S.A.

4. That the judicial person Bayer Crop Science SA
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 purposes 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 Weg 10,
51467 Bergisch Gladbach, Alemania
suscribió de su puño y letra el documento que antecede.

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

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

de la persona jurídica Bayer CropScience S.A.

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

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

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

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

COMO NOTARIA ONCE DE ESTE
CIRCULO HAGO CONSTAR QUE ESTA
FOTOCOPIA CONCORDA CON EL
ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
10 GO 2006

BOGOTA, D. C. COLOMBIA
NOT. CA ZULMA SAUTISTA NAVARRO
NOTARIA ONCE Notario Público

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Colombia

1. — République française

Le présent acte public

2. — a été signé par BOREL GILLYS Cédric3. — après avoir été revêtu de la qualité de Notaire4. — est revêtu de la signature de BOREL GILLYS Cédric
Chancelier (Notaire)

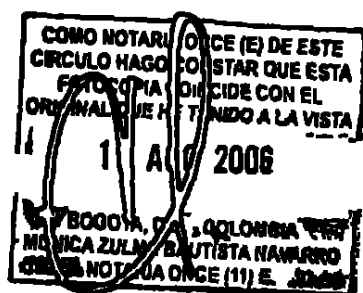
Attesté

5. — à Paris le 10 Mars 2006

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

8. — sous le n° HSE9. — Scellé

10. — Signature

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



00009

(43) International Publication Date
15 September 2005 (15.09.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/085238 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07D 409/12,
417/12, 401/12, A01N 43/42, 43/78, 43/60

(31) International Application Number:
PCT/EP2005/003282

(22) International Filing Date: 1 March 2005 (01.03.2005)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Date:
04356029.1 3 March 2004 (03.03.2004) EP

GH, GD, GE, GI, 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, SM, 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, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,
SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): MANSFIELD,
Darren James [GB/FR]; 25 montée Bonafous, F-69004
LYON (FR). RIECK, Helko [DE/FR]; 9 rue Claude
Monet, F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon (FR). CO-
QUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 36 rue de la Tête
d'Or, F-69006 LYON (FR). DESBORDES, Philippe
[FR/FR]; 30 rue Bancel, F-69007 LYON (FR). GROS-
JEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR]; Le Trève
Collonge, Route d'Albigny, F-69250 CURIS AU MONT
D'OR (FR). GENIX, Pierre [FR/FR]; 14 rue Duviard,
F-69004 LYON (FR). VILLIER, Alain [FR/FR]; 3
chemin des Garennes, F-69450 SAINT CYR AU MONT
D'OR (FR).

(74) Agent: AGASSE, Stéphane; Buyer CropScience SA,
Patents & Licensing Department, 14/20 rue Pierre Baizel,
F-69009 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,

Declarations under Rule 4.17:

— as to 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, GI, 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, SM, SY,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW. ARIPO patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent (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, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK,
TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

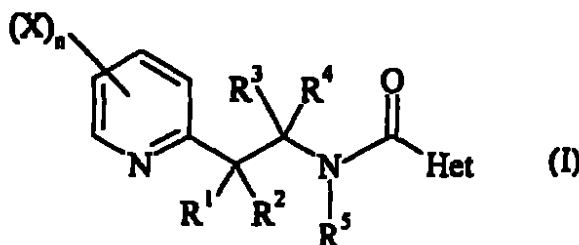
— of inventorship (Rule 4.17(iv)) for US only

Published:

— with international search report
— before the expiration of the time limit for amending the
claims and to be republished in the event of receipt of
amendments

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

(54) Title: 2-PYRIDINYLETHYLCARBOXAMIDE DERIVATIVES AND THEIR USE AS FUNGICIDES



(57) Abstract: A compound of general formula (I). A process
for preparing this compound. A fungicidal composition com-
prising a compound of general formula (I). A method for treating
plants by applying a compound of general formula (I) or a com-
position comprising it.

WO 2005/085238 A1

2-PYRIDINYLETHYLCARBOXAMIDE DERIVATIVES AND THEIR USE AS FUNGICIDES

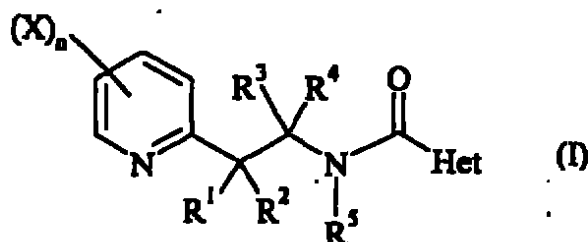
The present invention relates to novel N-[2-(2-pyridinyl)ethyl]carboxamides derivatives, their process of preparation, their use as fungicides, particularly in the form of fungicidal compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi of plants using these compounds or their compositions.

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 halogenoalkyl group.

It is always of high-interest in the agriculture field 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.

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

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



in which :

- n is 1, 2, 3 or 4;
- X is the same or different and is 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)-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-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, a C₁-C₆-alkoxyimino, 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, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl or a phenylamino;

- R¹, R², R³ and R⁴ are the same or different and are a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a 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-C₆-alkyl 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-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-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, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl or a phenylamino, a phenyl group, a phenyl sulphanyl group;

or R¹ and R² may form together a cyclopropyl, a cyclobutyl, a cyclopentyl or a cyclohexyl;

06022

with the proviso that when three of the four substituents R^1 , R^2 , R^3 and R^4 are a hydrogen atom, then the fourth substituent is not a hydrogen atom;

- R^5 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;

- Het represents 5-, 6- or 7-membered heterocycle with one, two or three heteroatoms which may be the same or different; Het being linked by a carbon atom and being at least substituted in ortho position;

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

In the context of the present invention :

- halogen means fluorine, bromine, chlorine or iodine;
- heteroatom means N, O or S;
- carboxy means $-C(=O)OH$;
- carbonyl means $-C(=O)-$;
- carbamoyl means $-C(=O)NH_2$;
- 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.

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

- as regards n, n is 1, 2 or 3. More preferably n is 2 or 3.

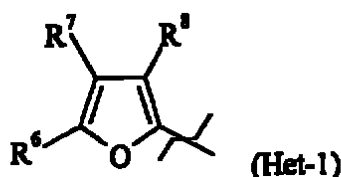
- as regards X, at least one of the X substituent is a halogen atom, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₆-alkoxyimino, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, or a C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkylcarbonyl.
- as regards the positions in which the 2-pyridyl is substituted, the 2-pyridyl is substituted in 3-, 5- and/or in 6-position. More preferably, the 2-pyridyl is substituted in 3- and/or in 5-position

According to the present invention, the two carbon atoms and the nitrogen atom of the "ethylamide part" of the compound of formula (I) are respectively substituted by R¹ and R², R³ and R⁴, and R⁵, at least one the substituents R¹, R², R³ and R⁴ being different from hydrogen. Preferably, the present invention also relates to N-[2-(2-pyridinyl)ethyl]carboxamide derivative of general formula (I) in which the following characteristics may be chosen alone or in combination as being :

- as regards R¹ and R², R¹ and R² may be chosen, independently of each other, as being 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-alkylcarbonylamino, a C₁-C₆-alkoxycarbonyloxy, a C₁-C₆-alkoxycarbonylamino or a phenyl group. More preferably, R¹ and R² may be chosen, independently of each other, as being a halogen atom, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₆-alkylcarbonylamino.
- as regards R³ and R⁴, R³ and R⁴ may be chosen, independently of each other, as being a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylcarbonylamino or a phenyl group. More preferably, R³ and R⁴ may be chosen, independently of each other, as being a halogen atom, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl group.
- as regards R⁵, R⁵ may be chosen as being a hydrogen atom or a C₃-C₇-cycloalkyl.

According to the present invention, "Het" of the compound of general formula (I) may be a five membered ring heterocycle. Specific examples of compounds of the present invention where Het is a five membered heterocycle include :

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-1)

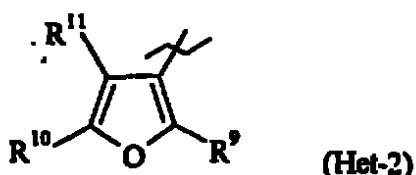


in which :

- R^6 and R^7 may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^8 may be a halogen atom, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-2)



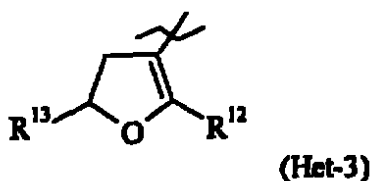
in which :

- R^9 may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{10} and R^{11} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

provided that the R^9 and R^{11} are not both a hydrogen atom.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-3)

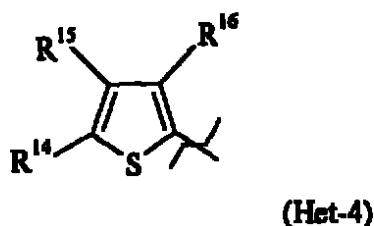


in which :

- R^{12} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{13} may be a hydrogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-4)

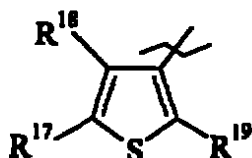


in which :

- R^{14} and R^{15} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl, a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl or a pyridyl optionally substituted by a halogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl; and

- R^{16} may be a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-5)



(Het-5)

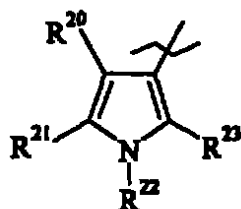
in which :

- R^{17} and R^{18} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkyloxy or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{19} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

provided that the R^{18} and R^{19} are not both a hydrogen atom.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-6)



(Het-6)

in which :

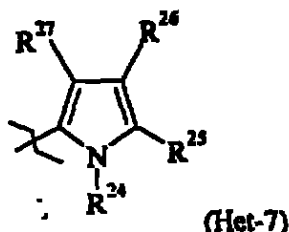
- R^{20} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R^{21} and R^{23} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{22} may be a hydrogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, a hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl, a di(C_1 - C_4 -alkyl)aminosulphonyl, a C_1 - C_4 -alkyl-

carbonyl, a phenylsulphonyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a benzoyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;
provided that the R²⁰ and R²³ are not both a hydrogen atom.

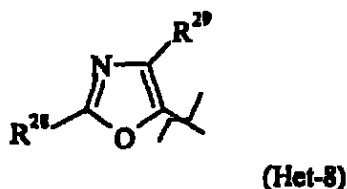
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-7)



in which :

- R²⁴ may be a hydrogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, a hydroxy-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkylsulphonyl, a di(C₁-C₄-alkyl)aminosulphonyl, a C₁-C₆-alkyl-carbonyl, a phenylsulphonyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a benzoyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and
- R²⁵, R²⁶ and R²⁷ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₄-alkylcarbonyl;
provided that R²⁴ and R²⁷ are not both a hydrogen atom.

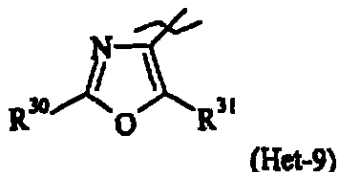
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-8)



in which :

- R²⁸ may be a hydrogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and
- R²⁹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-9)

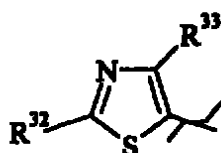


in which :

- R³⁰ may be a hydrogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and

- R^{31} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-10)



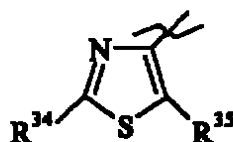
(Het-10)

in which :

- R^{32} may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkylamino, a di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl; and

- R^{33} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-11)



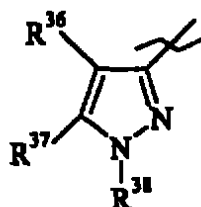
(Het-11)

in which :

- R^{34} may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkylamino, a di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{35} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-12)



(Het-12)

in which :

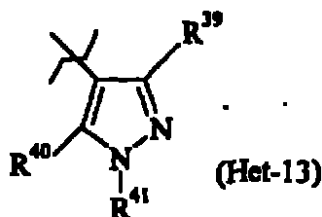
- R^{36} may be a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_3 - C_6 -cycloalkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -

halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, an aminocarbonyl group or an aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl;

- R³⁷ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy or a C₁-C₄-alkylthio; and

- R³⁸ may be a hydrogen atom, a phenyl, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a hydroxy-C₁-C₄-alkyl, a C₂-C₆-alkenyl, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkylthio-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkoxy-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-13)



in which :

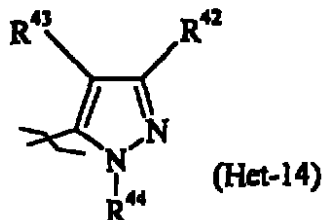
- R³⁹ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, an aminocarbonyl or an aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl;

- R⁴⁰ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₄-alkylthio; and

- R⁴¹ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a hydroxy-C₁-C₄-alkyl, a C₂-C₆-alkenyl, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkylthio-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkoxy-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl optionally substituted by a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxyalkyl or a nitro group;

provided that the R³⁹ and R⁴⁰ are not both a hydrogen atom.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-14)



in which :

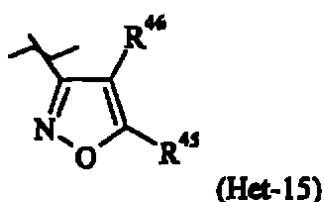
-R⁴² may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, an aminocarbonyl, or an aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl;

- R⁴³ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R⁴⁴ may be a hydrogen atom, a phenyl, a benzyl, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a hydroxy-C₁-C₄-alkyl, a C₂-C₆-alkenyl, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkylthio-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkoxy-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms;

provided that R⁴³ and R⁴⁴ are not both a hydrogen atom.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-15)

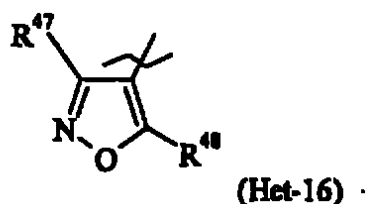


in which :

- R⁴⁵ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R⁴⁶ may be a halogen atom, a C-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-16)



in which R⁴⁷ and R⁴⁸ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5

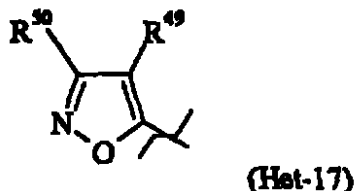
00028

15

halogen atoms, a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a heterocyclyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;

provided that R⁴⁷ and R⁴⁸ are not both a hydrogen atom.

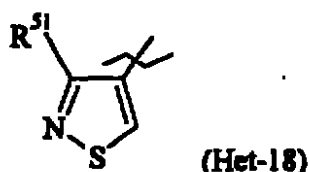
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-17)



in which :

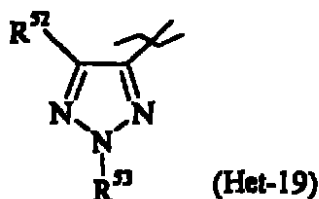
- R⁴⁹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, and
- R⁵⁰ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-18)



in which R⁵¹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

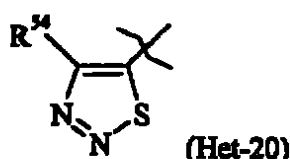
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-19)



in which :

- R⁵² may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and
- R⁵³ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, or a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl.

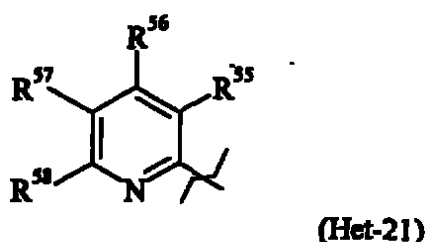
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-20)



in which R^{54} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

According to the present invention, "Het" of the compound of general formula (I) may be a six membered ring heterocycle. Specific examples of compounds of the present invention where Het is a six membered heterocycle include :

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-21)

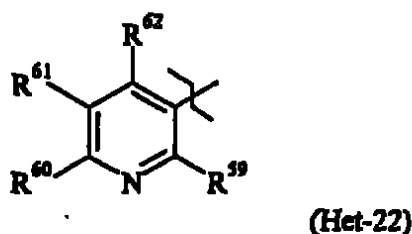


in which :

- R^{55} may be a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms or a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms;

- R^{56} , R^{57} and R^{58} , which may be the same or different, may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkylsulphinyl or a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-22)



in which :

- R^{59} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_5 -alkylthio, a C_2 - C_5 -alkenylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a phenyloxy

00032

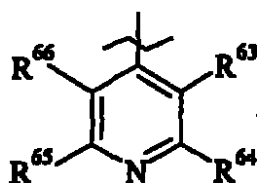
16

optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a phenylthio optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;

- R⁶⁰, R⁶¹ and R⁶², which may be the same or different, may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylsulphinyl, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a N-morpholine optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a thienyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;

provided that the R⁵⁹ and R⁶² are not both a hydrogen atom.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-23)

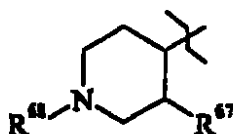


(Het-23)

in which R⁶³, R⁶⁴, R⁶⁵ and R⁶⁶, which may be the same or different, may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylsulphinyl or a C₁-C₄-alkylsulphonyl;

provided that the R⁶³ and R⁶⁶ are not both a hydrogen atom.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-24)



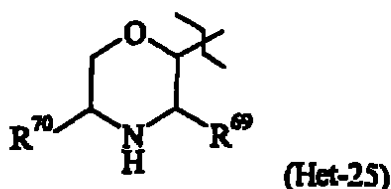
(Het-24)

in which :

- R⁶⁷ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R⁶⁸ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxycarbonyl, a benzyl optionally substituted by 1 to 3 halogen atoms, a benzyloxycarbonyl optionally substituted by 1 to 3 halogen atoms or a heterocyclyl.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-25)

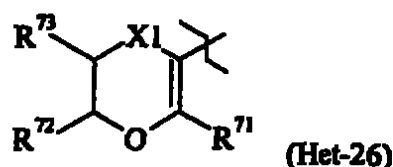


in which :

- R^{69} may be a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms or a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms;

- R^{70} may be a hydrogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a benzyl.

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-26)



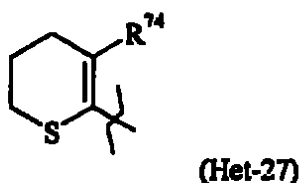
in which :

- X^1 may be a sulphur atom, $-SO-$, $-SO_2-$ or $-CH_2-$;

- R^{71} may be a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{72} and R^{73} may be the same or different and may be a hydrogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl.

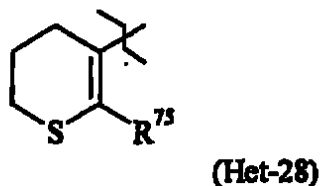
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-27)



in which :

- R^{74} may be a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-28)



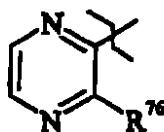
00024

17

in which :

- R^{75} may be a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

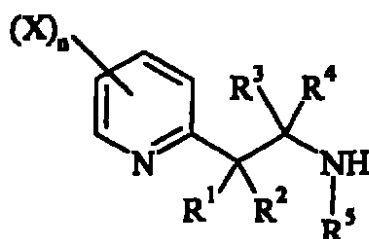
* Het may represent a heterocycle of the general formula (Het-29)



(Het-29)

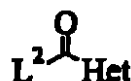
in which R^{76} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

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 for the preparation of compound of general formula (I) as defined above, which comprises reacting a 2-pyridine derivative of general formula (II) or one of its salt :



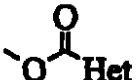
(II)

in which X, n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as defined above;
with a carboxylic acid derivative of the general formula (III)



(III)

in which :

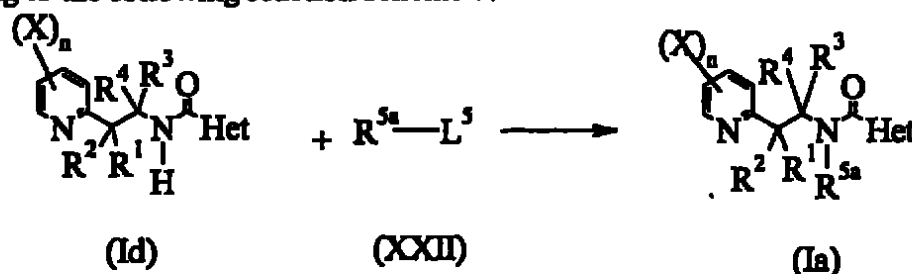
- Het is as defined above; and
- L^2 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, $-OR^{77}$, $-OCOR^{77}$, R^{77} being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl, pentafluorophenyl or a group of formula  ;

in the presence of a catalyst and, if L^2 is a hydroxyl group, in the presence of a condensing agent.

The process according to the present invention is conducted in the presence of a catalyst. Suitable catalyst may be chosen as being 4-dimethyl-aminopyridine, 1-hydroxy-benzotriazole or dimethylformamide.

In case L^2 is a hydroxy group, the process according to the present invention is conducted in the presence of condensing agent. Suitable condensing agent may be chosen as being acid halide former, such as phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; anhydride former, such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methanesulfonyl-chloride; carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or other customary condensing agents, such as phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyl-diimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane, 4-(4,6-dimethoxy[1.3.5]triazin-2-yl)-4-methylmorpholinium chloride hydrate or bromo-tripyrrolidino-phosphonium-hexafluorophosphate.

When R^3 is a hydrogen atom, the above mentioned process for the preparation of compound of general formula (I) may optionally be completed by a further step according to the following reaction scheme :



in which : - R^1, R^2, R^3, R^4, X, n and Het are as defined above;

- R^{5a} is 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; and

- L^5 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a 4-methyl phenylsulfonyloxy or a methylsulfonyloxy;

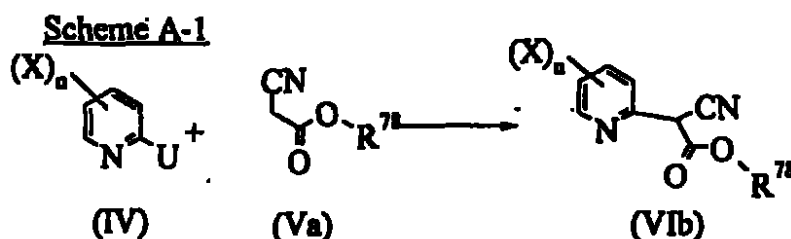
comprising the reaction of a compound of general formula (Id) with a compound of general formula (XXII) to provide a compound of general formula (Ia).

Depending on the definition of R^1 , R^2 , R^3 , R^4 or R^5 , amine derivatives of general formula (II) may be prepared by different processes. One example (A) of such a process may be when :

- X , n are as defined above;
- R^1 is a C_1 - C_6 alkyl;
- R^2 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl; and
- R^3 , R^4 , R^5 are hydrogen atoms;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process which comprises :

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



in which :

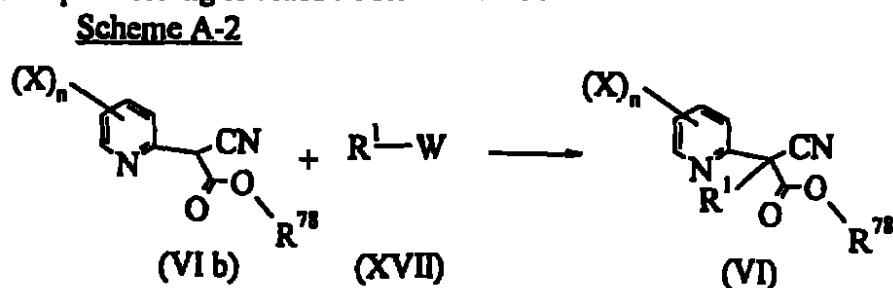
- X and n are as defined above;

- R^{78} 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 (Va) by a pyridine derivative of general formula (IV), to provide a 2-(pyridyl)cyanoacetate derivative of general formula (VI b), 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 :



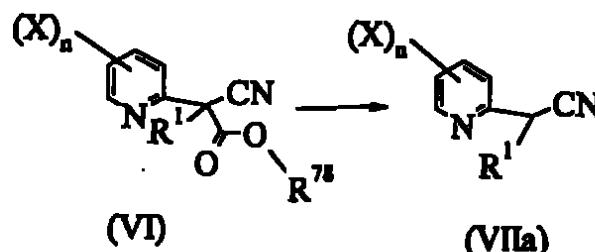
in which :

- X , n are as defined above;

- R^1 is a C_1 - C_6 alkyl;

- R^{78} is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- W is a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate;
- comprising the alkylation of a compound of general formula (VI b) by a reagent of general formula (XVII) to provide a compound of general formula (VI);
- a third step according to reaction scheme A-3 :

Scheme A-3

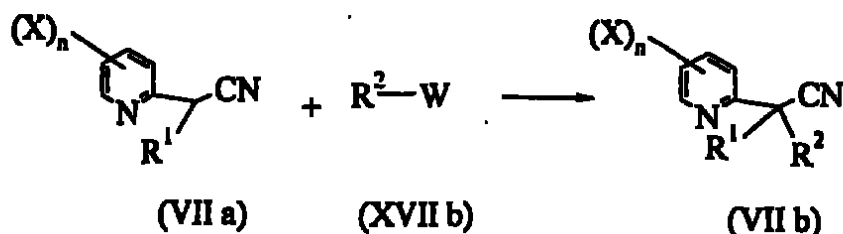
in which : - X, n are as defined above;

- R¹ is a C₁-C₆ alkyl;

- R⁷⁸ is a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a basic hydrolysis, an acidic hydrolysis or a displacement by an halide of a compound of general formula (VI) 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 (VIIa);

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

Scheme A-4

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

- R¹ is a C₁-C₆ alkyl;

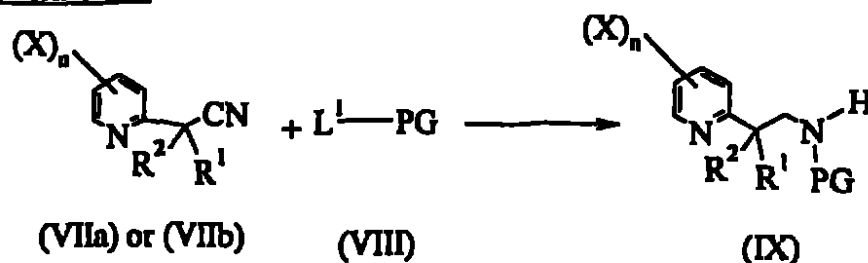
- R² is a C₁-C₆ alkyl;

- W is a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate or a 4-methyl-phenylsulfonate;

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

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

Scheme A-5



in which :

- X, n are as defined above;

- R^1 is a C_1 - C_6 alkyl;

- R^2 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl;

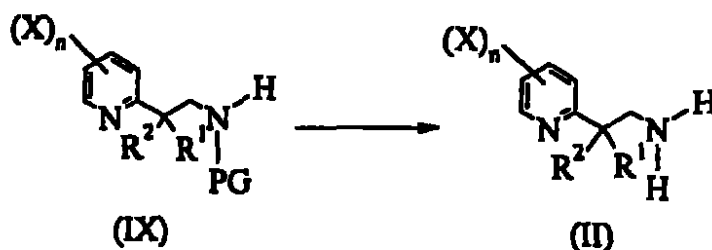
- L^1 is a leaving group chosen as being a $-OR^{77}$ group or a $-OCOR^{77}$ group, R^{77} being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-COOR^{77}$ group or $-COR^{77}$ group, R^{77} 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 (VIIa) or (VIIb), in the presence of a catalyst and in the presence of a compound of general formula (VIII) to produce a compound of general formula (IX), at a temperature of from $0^\circ C$ to $150^\circ C$ and under a pressure of from 1 bar and 100 bar,

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

Scheme A-6



in which :

- X, n are as defined above;

- R^1 is a C_1 - C_6 alkyl;

- R^2 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl

- PG represents a protecting group which may be a $-COOR^{77}$ group or $-COR^{77}$ group, R^{77} 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 (IX) to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

The first step (step A-1) 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) 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) 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) 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 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-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both.

The fifth step (step A-5) according to the present invention is conducted in the presence of a hydride donor. Preferably, the hydride donor is chosen as being metal or metalloids hydrides such as LiAlH₄, NaBH₄, KBH₄, B₂H₆.

The fifth step (step A-5) 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 fifth step (step A-5)) 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 fifth step (step A-5) 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 fifth step (step A-5) 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.

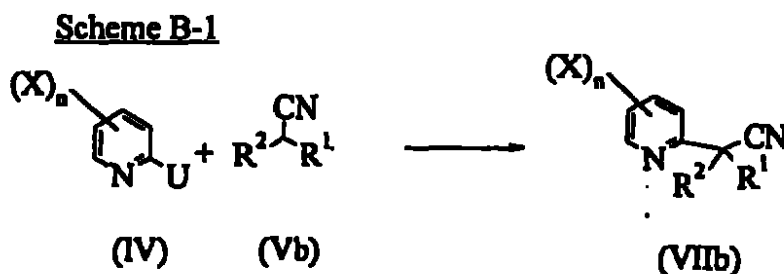
A second example (B) of such a process may be when :

- R^1 , R^2 , X, n are as defined above; and

- R^3 , R^4 , R^5 are hydrogen atoms;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process which comprises :

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



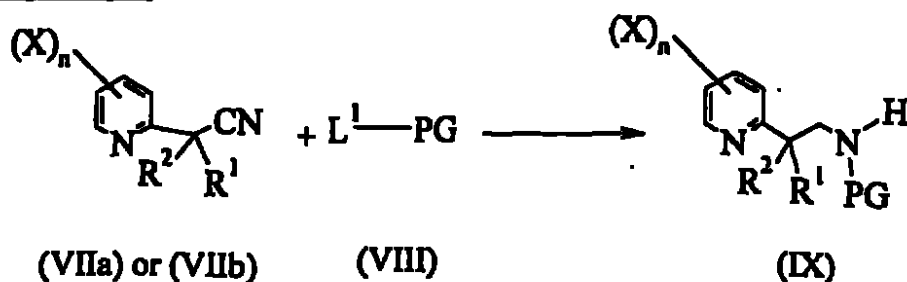
in which : - R^1 , R^2 , X and n are as defined above ;

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

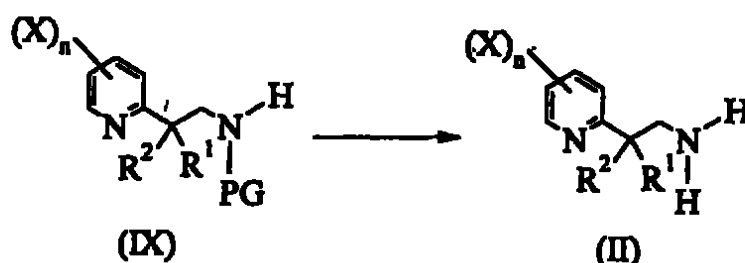
- a second step according to reaction scheme B-2 :

Scheme B-2



00031

- in which :
- R^1 , R^2 , X and n are as defined above;
 - L^1 is a leaving group chosen as being a $-OR^{79}$ group or a $-OCOR^{79}$ group, R^{79} 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 $-COOR^{79}$ group or $-COR^{79}$ group, R^{79} 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 (VIIa) or (VIIb), in the presence of a compound of general formula (VIII) to produce a compound of general formula (IX) ;
- a third step according to reaction scheme B-3 :

Scheme B-3

- in which :
- R^1 , R^2 , X and n are as defined above;
 - PG represents a protecting group which may be a $-COOR^{79}$ group or $-COR^{79}$ group, R^{79} 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 (IX) to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

The first step (step B-1) 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 .

The first step (step B-1) 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 B-1) 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 B-1) 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 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-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine and its corresponding enantiomer, or a mixture of both.

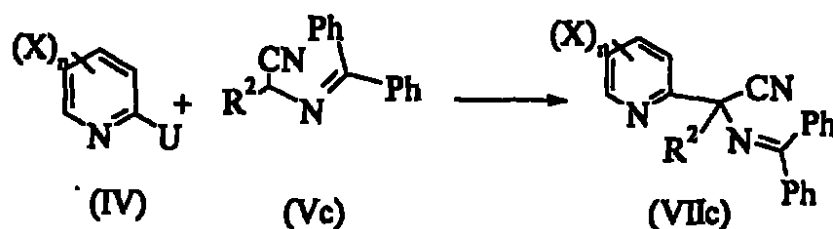
The preferred conditions under which step B-2 is conducted are the same than the preferred conditions under which step A-4 of the above mentioned process A is conducted.

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

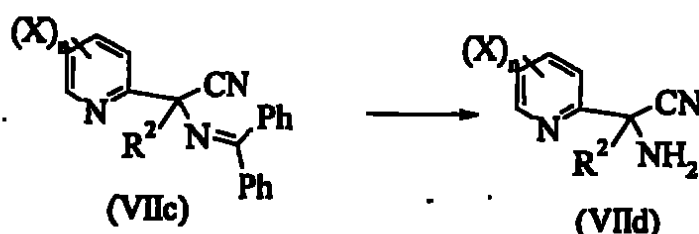
A third example (C) of such a process may be when :

- R^2 , X, n are as defined above;
 - R^1 is a formylamino, a C_1 - C_8 -alkylcarbonylamino, a C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a phenylcarbonylamino or a 2,6-dichlorophenylcarbonylamino; and
 - R^3 , R^4 , R^5 are hydrogen atoms;
- then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process comprising :
- a first step according to reaction scheme C-1 :

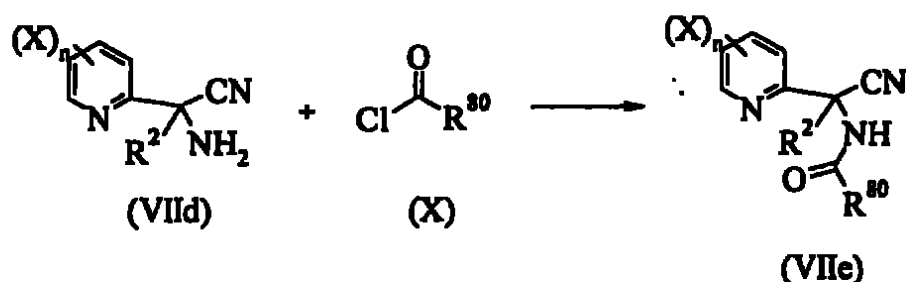
Scheme C-1



- in which :
- R^2 , X, 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 (Vc) by a pyridine derivative of general formula (IV) to provide a 2-pyridylacetonitrile derivative of general formula (VIIc), in the presence of a base and at a temperature of from -100°C to 200°C;
- a second step according to reaction scheme C-2 :

Scheme C-2

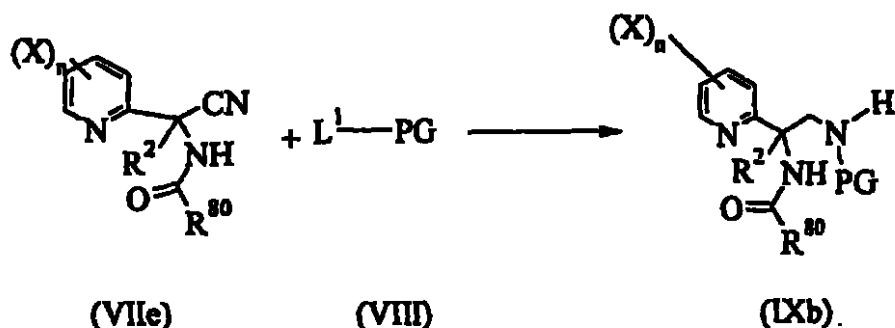
- in which R^2 , X, n are as defined above;
- comprising the de-protection, by acidic hydrolysis, of a compound of general formula (VIIc), to produce a compound of general formula (VIIId) or one of its salt ;
- a third step according to reaction scheme C-3 :

Scheme C-3

- in which :
- R^2 , X, n are as defined above;
 - R^{80} is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl group, a C_1 - C_6 halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a phenyl or 2,6 dichlorophenyl ;
- comprising the coupling between a compound of general formula (VIIId) and an acyl chloride of general formula (X) to produce a compound of general formula (VIIe).

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

Scheme C-4



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

- R^{80} is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl group, a C_1 - C_8 halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a phenyl or 2,6 dichlorophenyl;

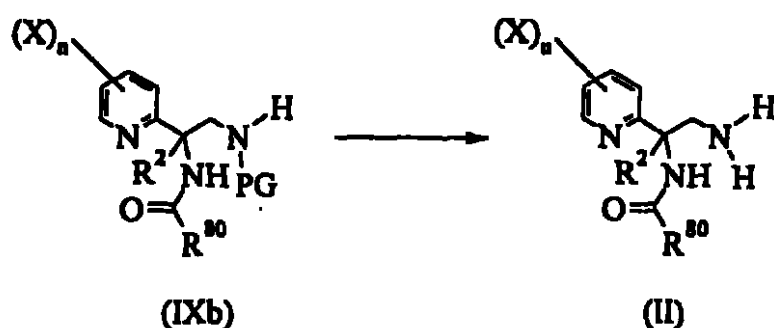
- L^1 is a leaving group chosen as being a $-OR^{79}$ group or a $OCOR^{79}$ group, R^{79} being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-COOR^{79}$ group or $-COR^{79}$ group, R^{79} 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 (VIIe), in the presence of a compound of general formula (VIII) to produce a compound of general formula (IXb);

- a fifth step according to scheme C-5

Scheme C-5



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

- R^{80} is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl group, a C_1 - C_8 halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a phenyl or 2,6 dichlorophenyl;

- L^1 is a leaving group chosen as being a $-OR^{79}$ group or a $OCOR^{79}$ group, R^{79} 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 $-\text{COOR}^{79}$ group or $-\text{COR}^{79}$ group, R^{79} 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 (IXb) to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

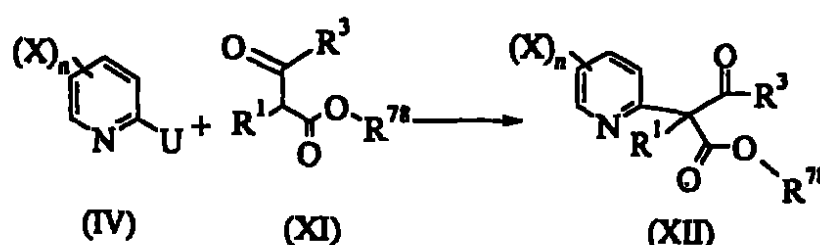
A fourth example (D) of such a process may be when :

- R^1 , X, Y, n and p are as defined above;
- R^2 is a hydrogen atom;
- R^3 is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl or a phenyl; and
- R^5 is a hydrogen atom, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkoxy or a $\text{C}_3\text{-C}_7$ cycloalkyl;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process comprising :

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

Scheme D-1



in which :

- R^1 , X and n are as defined above;

- R^3 is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl or a phenyl;

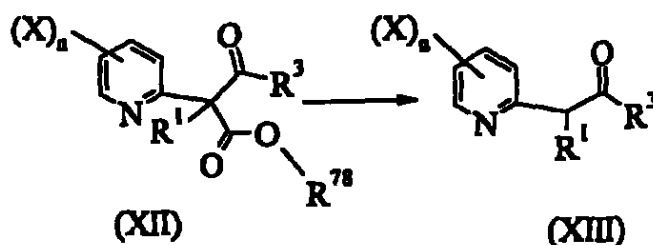
- R^{78} is a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- U is a leaving group chosen as being a halogen, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkylsulfonate or a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkylsulfonate;

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

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

Scheme D-2

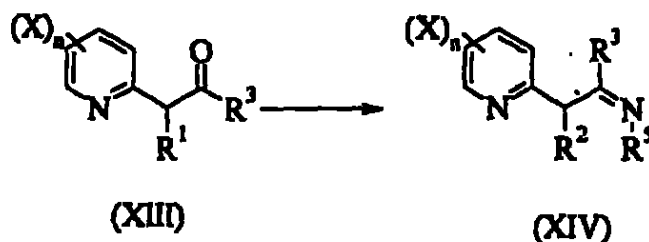


- in which :
- R^1 , X , n are as defined above;
 - R^2 is a hydrogen atom;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl or a phenyl;
 - R^{78} is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

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

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

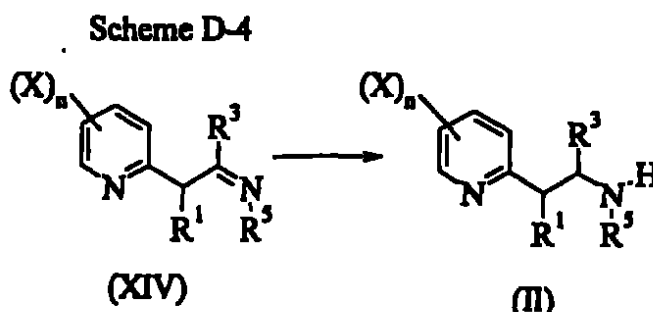
Scheme D-3



- in which :
- R^1 , X and n are as defined above;
 - R^2 is a hydrogen atom;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl or a phenyl;
 - R^5 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 (XIII) with an amine of formula R^5 -NH₂ to provide an imine derivative of general formula (XIV);

- a fourth step according to scheme D-4 :



- in which :
- R^1 , X and n are as defined above;
 - R^2 is a hydrogen atom;
 - R^3 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, a phenyl;
 - R^5 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 reduction of an imine derivative of general formula (XIV) by hydrogenation or by an hydride donor, in the same or a different pot to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

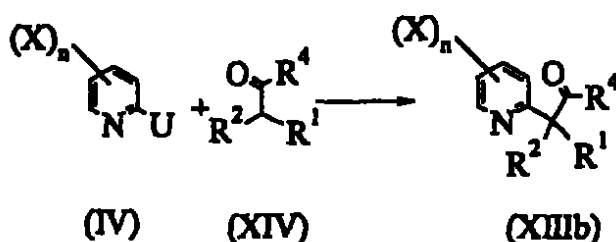
A fifth example (E) of such a process may be when :

- R^1 , R^2 , X, Y, n and p are as defined above;
- R^3 is a hydrogen atom
- R^4 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, a phenyl; and
- R^5 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;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process comprising :

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

Scheme E-1



- in which :
- R^1 , R^2 , X and n are as defined above;
 - R^4 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl or a phenyl;
 - U is a leaving group chosen as being a

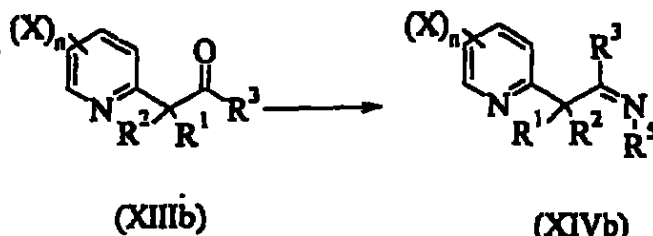
halogen, a C_1 - C_6 alkylsulfonate or a C_1 - C_6 haloalkylsulfonate;

comprising the arylation of a ketone derivative of general formula (XIV) by a pyridine derivative of general formula (IV), to provide a 2-(pyridyl)ketone derivative of

general formula (XIIIb), in the presence of a base, at a temperature of from 0°C to 200°C;

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

Scheme E-2



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

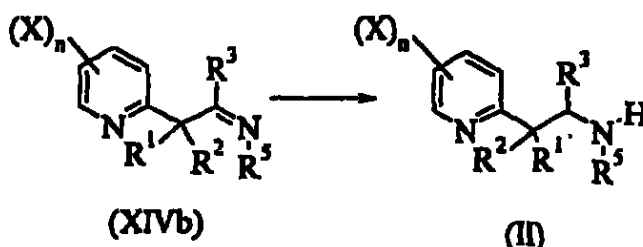
- R^4 is a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl or a phenyl;

- R^5 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 (XIIIb) with an amine of formula R^5-NH_2 to provide an imine derivative of general formula (XIVb);

- a third step according to scheme E-3 :

Scheme E-3



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 or a phenyl;

- R^4 is a hydrogen atom;

- R^5 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 reduction of an imine derivative of general formula (XIVb) by hydrogenation or by an hydride donor, in the same or a different pot to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

A sixth example (F) of such a process may be when :

- R^2, X, n are as defined above;

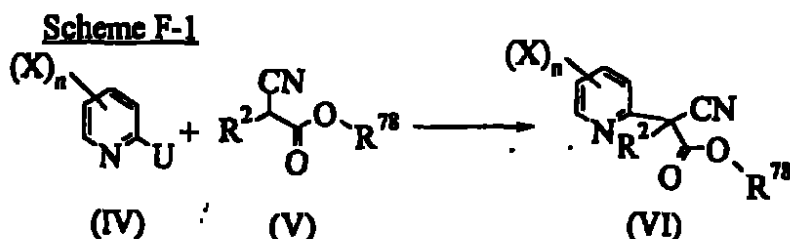
- R^1 is a cyano group, a hydroxy group, a C_2 - C_6 -alkynyl, a C_1 - C_6 -alkylamino, a di- C_1 - C_6 -alkylamino, a C_1 - C_6 -alkoxy, a C_1 - C_6 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen

atoms, a C₁-C₆-alkylsulfanyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenyloxy, a C₂-C₆-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-alkynyloxy, a C₃-C₆-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl, a phenylamino, or a phenyl sulphanyl group, a C₁-C₆-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms; and

- R³ and R⁴ are hydrogen atoms;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process comprising :

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



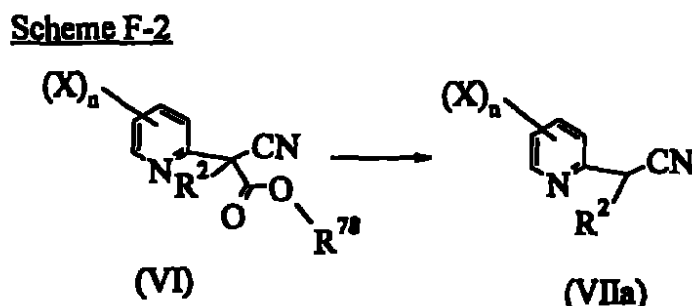
in which : - R², X and n are as defined above;

- R⁷⁸ is a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

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

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

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



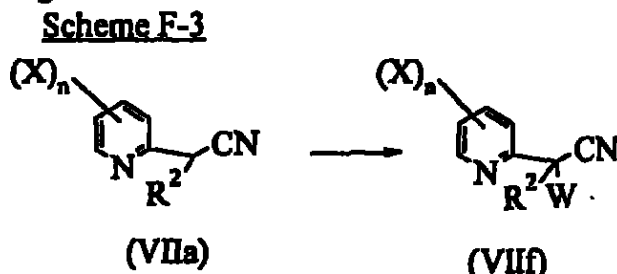
in which : - R², X, n are as defined above;

- R¹ is a hydrogen atom;

- R⁷⁸ is a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a basic hydrolysis, an acidic hydrolysis or a displacement by an halide of a compound of general formula (VI) 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 (VIIa);

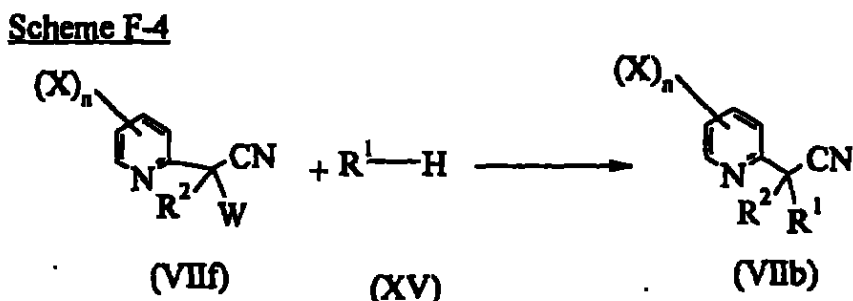
- a third step according to reaction scheme F-3 :



in which : - R^2 , X, n are as defined above;
- W is a halogen atom;

comprising the halogenation of a compound of general formula (VIIa) to provide a compound of general formula (VIIf);

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

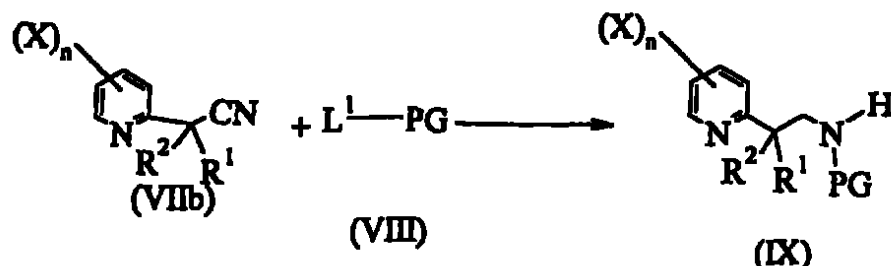


in which : - R^2 , X, n are as defined above;
- W is a halogen atom;
- R^1 is a cyano group, a hydroxy group, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkynyl, a

$\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylamino, a di- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylamino, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoxy, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylsulfanyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkenyloxy, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alkynyloxy, a $\text{C}_3\text{-C}_6$ -halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl, a phenylamino, or a phenyl sulphanyl group, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylcarbonyloxy or a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms;
comprising the nucleophilic substitution, in the presence of a base, of a compound of general formula (VIIf) in the presence of a compound of general formula (XV) to produce a compound of general formula (VIIb), at a temperature of from -78°C to 150°C;

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

Scheme F-5



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

- R^1 is a cyano group, a hydroxy group, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkynyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylamino, a di- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylamino, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoxy, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylsulfanyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkenyloxy, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alkynyloxy, a $\text{C}_3\text{-C}_6$ -halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl, a phenylamino, or a phenyl sulphanyl group, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylcarbonyloxy or a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms;

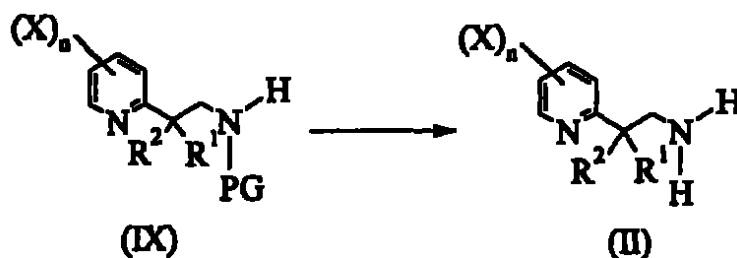
- L^1 is a leaving group chosen as being a $-\text{OR}^{79}$ group or a $-\text{OCOR}^{79}$ group, R^{79} being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^{79}$ group or $-\text{COR}^{79}$ group, R^{79} 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 (VIIb), in the presence of a catalyst and in the presence of a compound of general formula (VIII) to produce a compound of general formula (IX), at a temperature of from 0°C to 150°C and under a pressure of from 1 bar and 100 bar;

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

Scheme F-6



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

- R^1 is a cyano group, a hydroxy group, a $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkynyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylamino, a di- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkylamino, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoxy, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ -halogenoalkoxy

having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylsulfanyl, a C₁-C₆-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₆-alkenyloxy, a C₂-C₆-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-alkynyloxy, a C₃-C₆-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl, a phenylamino, or a phenyl sulphanyl group, a C₁-C₆-alkylcarbonyloxy or a C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms;

- PG represents a protecting group which may be a -COOR⁷⁹ group or -COR⁷⁹ group, R⁷⁹ 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 (IX) to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

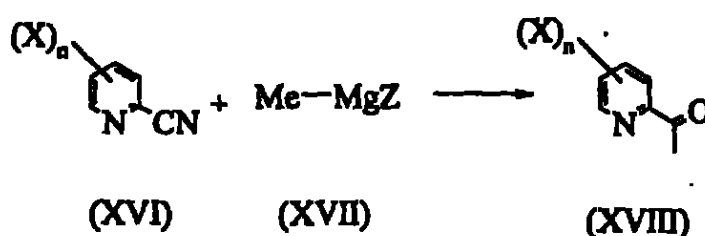
A seventh example (G) of such a process may be when :

- X, n are as defined above;
- R¹ is a hydroxy group; and
- R³, R², and R⁴ are hydrogen atoms;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process comprising :

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

Scheme G-1



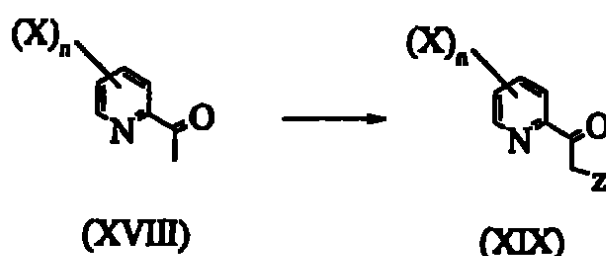
- in which :
- X and n are as defined above;
 - Z is a halogen atom;

comprising the addition of a methyl magnesium halogenide of general formula (XVII) on a pyridine derivative of general formula (XVI) to provide a compound of general formula (XVIII);

00013

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

Scheme G-2

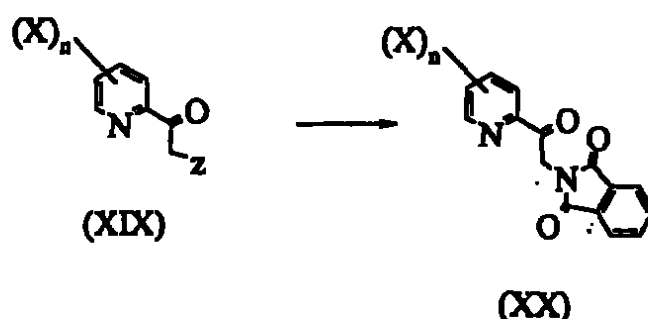


in which : - X and n are as defined above;
 - Z is a halogen atom;

comprising the halogenation of a compound of general formula (XVIII) into a compound of general formula (XIX) by use of a halogenating agent such as chlorine, bromine, hypochlorite ions, hypobromite ions, trichloride ions, tribromide ions, N-chloro imides, N-chloro amides, N-chloro amines, N-bromo imides, N-bromo amides or N-bromo amines;

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

Scheme G-3

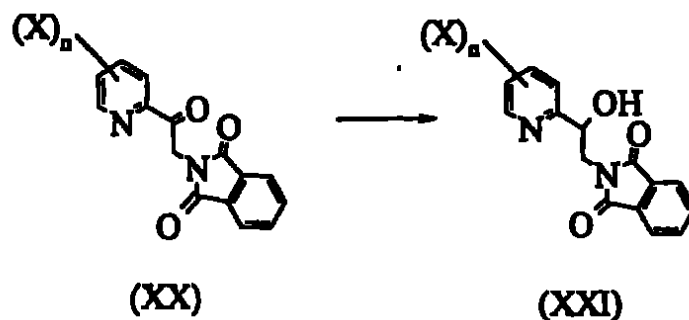


in which : - X and n are as defined above;
 - Z is a halogen atom;

comprising the nucleophilic substitution of a compound of general formula (XIX) by a phthalimide salt to produce a compound of general formula (XX);

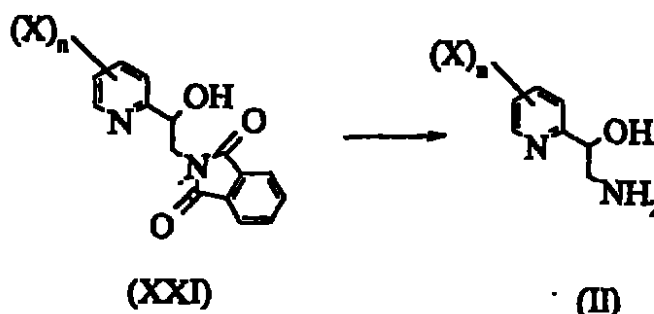
- a fourth step according to reaction scheme G-4 :

Scheme G-4



000/27

in which X and n are as defined above;
 comprising the reduction of a compound of general formula (XX) by a hydride donor
 to produce a compound of general formula (XXI);
 - a fifth step according to reaction scheme G-5 :

Scheme G-5

in which X and n are as defined above;
 comprising the de-protection of a compound of general formula (XXI) by reacting it
 with hydrazine hydrate or a hydrazine salt to provide an amine derivative of general
 formula (II) or one of its salt;

Compounds according to the present invention can be prepared according to the above described processes. It will nevertheless be understood that, on the basis of his general knowledge and of available publications, the skilled worker will be able to adapt these processes according to the specifics of each of the compounds 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.

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 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.

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, 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 crops such as *Rosaceae* sp. (for instance pip fruits such as apples and pears, but also stone fruits such as apricots, almonds and peaches), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (for instance banana trees and plantains), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (for instance lemons, oranges and grapefruits); leguminous crops such as *Solanaceae* sp. (for instance tomatoes), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (for instance lettuces), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (for instance peas), *Rosaceae* sp. (for instance strawberries); big crops such as *Graminae* sp. (for instance maize, cereals such as wheat, rice, barley and triticale), *Asteraceae* sp. (for instance sunflower), *Cruciferae* sp. (for instance colza), *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 yallundae*, *Tapesia acuiformis*), 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 yallundae*), 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 biwelli*) 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*).

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.

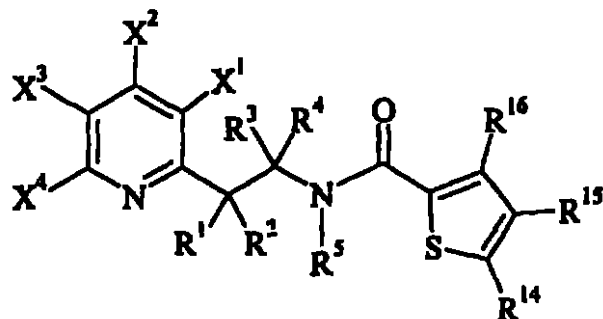
The dose of active material usually applied in the treatment according to the present invention is generally and advantageously between 10 and 800 g/ha, preferably

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 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.

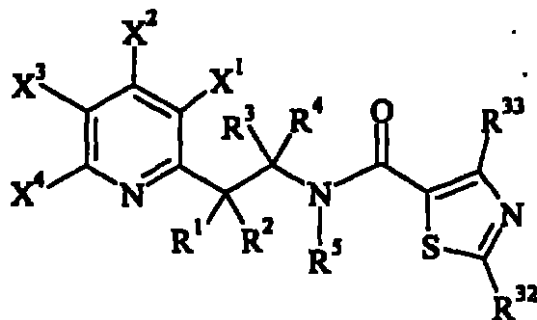
The fungicidal composition according to the present invention may also be used in the treatment of genetically modified organisms with the compounds according to the invention or the agrochemical compositions according to the invention. Genetically modified plants are plants into whose genome a heterologous 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 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 and candidiases 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 Tables A to C illustrate in a 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.p. means melting point.

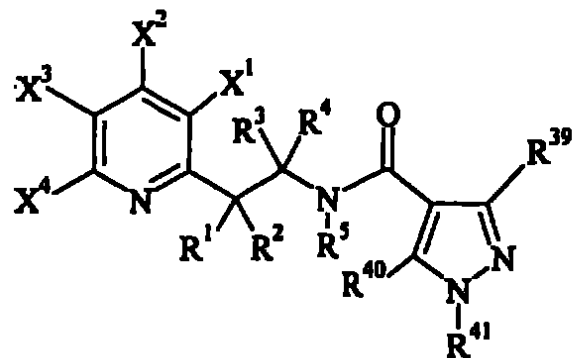
Table A

Compound	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	M+1	m.p. (°C)
A-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	H	H	I	441 at 1 ³⁵ Cl	-
A-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	I	407 at 1 ³⁵ Cl	-
A-3	H	CO ₂ H	H	H	H	F	H	Cl	F	H	H	I	-	192

Table B

Compound	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ³²	R ³³	M+1
B-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	Me	CF ₃	398 at 1 ³⁵ Cl
B-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	Me	CF ₃	364 at 1 ³⁵ Cl

Table C



Compound	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	M+1
C-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	381 at 1 ³⁵ Cl
C-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	347 at 1 ³⁵ Cl
C-3	Cyclopentyl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CHF ₂	H	Me	381 at 1 ³⁵ Cl
C-4	H	Et	H	H	H	H	H	Cl	H	CHF ₂	H	Me	347 at 1 ³⁵ Cl

0002

31

Examples of process for the preparation of the compound of general formula (I)

Preparation of N-[2-(5-chloro-2-pyridinyl)propyl]-1-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide

Preparation of *ter*-butyl 2-cyano-2-(5-chloro-2-pyridinyl)propanoate

To 150 ml of dimethoxyethane was slowly added portion-wise at 0°C, 11.6 g (0.29 mol) of sodium hydride (60% dispersion in mineral oil). To this suspension, was further added dropwise at 5°C, 21.1 g (0.149 mol) of *ter*-butyl cyanoacetate in 50 ml of dimethoxyethane. The suspension was stirred for 45 mn at room temperature. To the suspension were successively added 20 g (0.136 mol) of 2,5-dichloropyridine, 0.73 g (1.36 mmol) of (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-*ter*-butylphosphine, and 1.56 g (2.7 mmol) of bis(dibenzylideneacetone)palladium(0). The black mixture was heated at reflux for 4 hours. After cooling at room temperature, 12.7 ml (0.2 mol) of methyl iodide were added dropwise and the mixture was further stirred at room temperature for 17 hours. The reaction mixture was poured into 100 ml of 1N chlorhydric acid and 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 44.56 g of the crude product as a brown oil. The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate : 8/2) to give *ter*-butyl 2-cyano-2-(5-chloro-2-pyridinyl)propanoate: 23.44 g (64%) as a yellow oil.

Mass spectrum : [M+1] = 267.

Preparation of 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propanenitrile

To a solution of 23 g (0.086 mol) of *ter*-butyl 2-cyano-2-(5-chloro-2-pyridinyl)propanoate in 150 ml of toluene, was added 7.4 g (0.043 mol) of *p*-toluenesulfonic acid monohydrate. The mixture was stirred for 1,5 hours at 110°C. After cooling, the reaction mixture was poured into ice water and the pH was brought to 8 by addition of aqueous sodium hydrogenocarbonate.

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 15.4 g of the crude product as an orange oil. The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 8/2) to give 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propanenitrile: 7.8 g (54%) as a yellow oil.

Mass spectrum : $[M+1] = 167$.

Preparation of *ter*-butyl 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propylcarbamate

To a solution of 5.2 g (0.031 mol) of 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propanenitrile in 60 ml of methanol were rapidly added 8 g (0.034 mol) of cobalt(II) chloride hexahydrate and 13.5 g (0.062 mol) of di-*ter*-butyl dicarbonate. The dark solution was cooled to -5°C and 8.2 g (0.217 mol) of sodium borohydride was added portion-wise at 0°C. The reaction mixture was stirred at room temperature for 1 hour. The reaction mixture was neutralized by 100 ml of 1 N hydrochloric acid and methanol was removed under reduced pressure. The aqueous phase was reextracted by ethyl acetate (2 x 150 ml) and the organic phase was washed with brine and dried over magnesium sulphate.

The solvent was evaporated under reduced pressure to give 11.7 g of the crude product as a black oil. The crude product was purified by flash chromatography on silica gel (eluent: heptane/ethyl acetate: 9/1) to give *ter*-butyl 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propyl carbamate: 4.8 g (57%) as a yellow oil.

Mass spectrum : $[M+1] = 271$.

Preparation of 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propylamine hydrochloride

To a solution of 4.8 g (0.018 mol) of *ter*-butyl 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propyl carbamate in 30 ml of diethyl ether were added 44 ml (0.089 mol) of a 2M solution of hydrogen chloride in diethyl ether. The mixture was stirred 3 hours at room temperature.

The solid was filtered and dried overnight under vacuum to give 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propylamine hydrochloride : 3.5 g (94%) as a yellow solid.

Mass spectrum : $[M+1] = 169$.

00054

32

Preparation of N-[2-(5-chloro-2-pyridinyl)propyl]-1-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide

To a suspension of 100 mg (0.48 mmol) of 2-(5-chloro-2-pyridinyl)propylamine hydrochloride in 3 ml of dichloromethane was added successively 240 μ l (1.68 mmol) of triethylamine and 113 mg (0.58 mmol) of 1-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carbonyl chloride. The mixture was stirred 4 hours at room temperature. The reaction mixture was poured into water and the pH brought to 4.

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-(5-chloro-2-pyridinyl)propyl]-1-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide as a yellow oil : 40 mg (24%) as a yellow oil.

Mass spectrum : $[M+1] = 347$.

Examples of biological activity of the compound of general formula (I)

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

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.

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.

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 12-13-day-old culture.

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

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

Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 330ppm with the following compounds : A1.

Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 125ppm with the following compound : C4.

Example B: *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 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.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Pyrenophora teres* spores (12,000 spores per ml). The spores are collected from a 12-day-old culture. The contaminated barley plants are incubated for

24 hours at about 20°C and at 100% relative humidity, and then for 12 days at 80% relative humidity.

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

Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 330 ppm with the following compounds : A1, B1, C1, C2 and D1.

Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 125ppm with the following compound : C4.

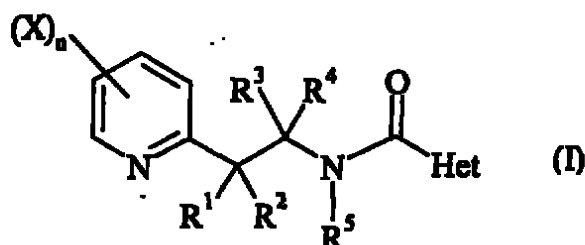
The N-{1-methylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]-ethyl}-4-phenylbenzamide disclosed by Patent Application WO 01/11965 (see compound 316 in Table D) showed poor effectiveness on *Alternaria brassicae*, and zero effectiveness on *Botrytis cinerea* at 330 ppm; the N-{1-ethylcarbamoyl-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-3-nitrobenzamide 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 compounds 306, 310 and 315 in Table D) showed zero effectiveness on *Botrytis cinerea* at 330 ppm.

The N-{[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]methyl}-5-thienylacetamide disclosed by Patent Application WO 01/11965 (see compound 101 in table B) showed poor efficacy against *Alternaria brassicae* and no efficacy against *Botrytis cinerea* and *Peronospora parasitica* at 330 ppm.

00057

CLAIMS

1. A compound of general formula (I) :



in which :

- n is 1, 2, 3 or 4;

- X is the same or different and is 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)-C₁-C₆-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-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkoxyimino, 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, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl or a phenylamino;

- R^1 , R^2 , R^3 and R^4 are the same or different and are a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a 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_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 -alkylsulfanyl, a C_1 - C_6 -halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_2 - C_6 -alkenylloxy, a C_2 - C_6 -halogenoalkenylloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_3 - C_6 -alkynylloxy, a C_3 - C_6 -halogenoalkynylloxy 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 -alkyloxycarbamoyl, 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 benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl or a phenylamino, a phenyl group, a phenyl sulphanyl group;

or R^1 and R^2 may form together a cyclopropyl, a cyclobutyl, a cyclopentyl or a cyclohexyl;

with the proviso that when three of the four substituents R^1 , R^2 , R^3 and R^4 are a hydrogen atom, then the fourth substituent is not a hydrogen atom;

- R^5 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 -halogenoalkylcarbonyl 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;

- Het represents 5-, 6- or 7-membered heterocycle with one, two or three heteroatoms which may be the same or different; Het being linked by a carbon atom and being at least substituted in ortho position;

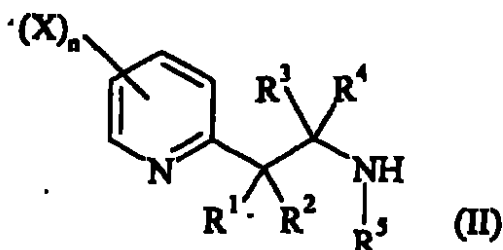
as well as its salts, N-oxydes, metallic and metalloidal complexes.

2. A compound according to claim 1, characterised in that n is 1, 2 or 3.
3. A compound according to claim 1 or 2, characterised in that at least one of the X substituent is a halogen atom, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-alkoxyimino, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, or a C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkylcarbonyl.
4. A compound according to any of the claims 1 to 3, characterised in that the 2-pyridyl is substituted in 3-, 5- and/or in 6-position.
5. A compound according to any of the claims 1 to 4, characterised in that R¹ and R² are chosen, independently of each other, as being 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-alkylcarbonylamino, a C₁-C₆-alkoxycarbonyloxy, a C₁-C₆-alkoxycarbonylamino or a phenyl group.
6. A compound according to claim 5, characterised in that R¹ and R² are chosen, independently of each other, as being a halogen atom, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₆-alkylcarbonylamino.
7. A compound according to any of the claims 1 to 6, characterised in that R³ and R⁴ are chosen, independently of each other, as being a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkylcarbonylamino or a phenyl group.
8. A compound according to claim 7, characterised in that R³ and R⁴ are chosen, independently of each other, as being a halogen atom, a C₁-C₆-alkyl, a C₁-C₆-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl group.
9. A compound according to any of the claims 1 to 8, characterised in that R⁵ is a hydrogen atom or a C₃-C₇-cycloalkyl.

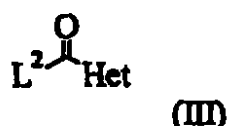
10. A compound according to any of the claims 1 to 9, characterised in that Het is a five membered ring heterocycle.

11. A compound according to any of the claims 1 to 9, characterised in that Het is a six membered ring heterocycle.

12. A process for the preparation of a compound of general formula (I) as defined in any of the claims 1 to 11, which comprises reacting a 2-pyridine derivative of general formula (II) or one of its salt :



in which X, n, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as in any of the preceding claims;
with a carboxylic acid derivative of the general formula (III)

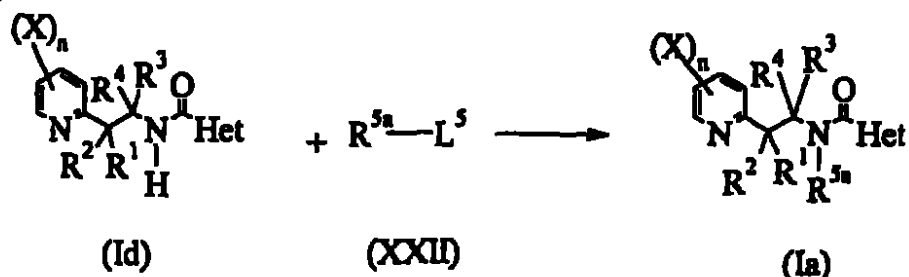


in which :

- Het is as defined in any of the preceding claims ; and
- L² is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OR⁶, -OCOR⁶, R⁶ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl, pentafluorophenyl or a group of formula ;

in the presence of a catalyst and, if L² is a hydroxyl group, in the presence of a condensing agent.

13. A process according to claim 12, characterised in that R⁵ is a hydrogen atom and that the process is completed by a further step according to the following reaction scheme :



in which : - R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X, n and Het are as defined in any of the claims 1 to 15;

- R^{5a} is 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; and

- L^5 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a 4-methyl phenylsulfonyloxy or a methylsulfonyloxy;

comprising the reaction of a compound of general formula (Id) with a compound of general formula (XXII) to provide a compound of general formula (Ia).

14. A fungicidal composition comprising an effective amount of a compound according to any of the claims 1 to 11 and an agriculturally acceptable support.

15. A 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 14 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.

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA BAJO EL TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de la Propiedad Intelectual
Oficina Internacional



(43) Fecha de publicación Internacional
15 Septiembre 2005 (19.09.2005)

(10) Número de publicación Internacional
WO 2005/085238 A1

- (51) Clasificación Internacional de Patentes⁷:
417/12, 401/12, A01N 43/42, 43/78, 43/60 C07D 408/12
- (21) Número de solicitud Internacional:
PCT/EP2005/003282
- (22) Fecha de presentación Internacional:
1 Marzo 2005 (01.03.2005)
- (25) Idioma de la presentación:
Inglés
- (26) Idioma de la publicación:
Inglés
- (30) Datos de prioridad:
04356029.1 3 Marzo 2004 (03.03.2004) EP
- (71) Solicitante (para todos los Estados designados excepto EE.UU.): BAYER CROPSCIENCE S.A. [FR/FR]; 18 Rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon (FR).
- (72) Inventores; e
(73) Inventores/Solicitantes (solamente para EE.UU.): MANSFIELD, Darren James [GB/FR]; 25 montée Bonafous, F-69004 LYON (FR). RIECK, Helmut [DE/FR]; 9 rue Claude Monet, F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon (FR). COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 36 rue de la Tête d'Or, F-69006 LYON (FR). DEBORDS, Philippe [FR/FR]; 30 Rue Bancal, F-69007 LYON (FR). GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR]; La Trêve Collonge, route d'Albigny, F-69250 CURIS AU MONT D'OR (FR). GENIX, Pierre [FR/FR]; 14 Rue Duviard, F-69004 LYON (FR). VILLIER, Alain [FR/FR]; 3 chemin des Garennes, F-69460 SAINT CYR AU MONT D'OR (FR).
- (74) Agente: AGASSE, Stéphane; Bayer CropScience S.A., Patents & Licensing Department, 14/20 rue Pierre Balzac, F-69009 Lyon (FR).
- (81) Estados designados (a menos que se indique otra cosa, para todo tipo de protección nacional disponible): 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, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Estados designados (a menos que se indique otra cosa, para todo tipo de protección regional disponible): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Euroasática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, 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).

Declaraciones según la Regla 4.17:

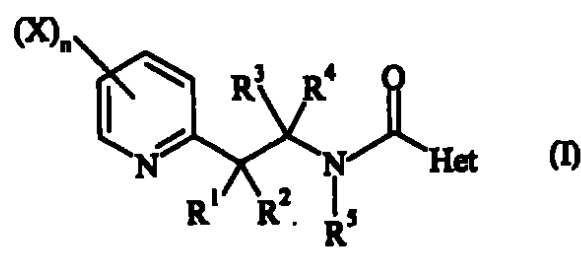
- En relación a la capacidad del solicitante de presentar y serie concedida una patente (Regla 4.17(ii)) para las siguientes designaciones: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, 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, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW. Patente ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW). Patente Euroasática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM). Patente Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR). Patente OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- del inventor (Regla 4.17(iv)) solo para EE.UU.

Publicada:

- Con informe de búsqueda internacional.
- Antes de expirar el plazo previsto para la modificación de las reivindicaciones, se volverá a publicar si se reciben las modificaciones.

Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, se hace referencia a "Notas de Guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparecen al comienzo de cada índice regular del Boletín PCT.

(54) Título: DERIVADOS DE 2-PIRIDINILETILCARBOXAMIDA Y SU USO COMO FUNGICIDAS



(57) Resumen: Un compuesto de fórmula general (I). Un procedimiento para preparar este compuesto. Una composición fungicida que comprende un compuesto de fórmula general (I). Un método para tratar plantas mediante la aplicación de un compuesto de fórmula general (I) o una composición que lo comprenda.

Derivados de 2-piridiniletícarboxamida y su uso como fungicidas

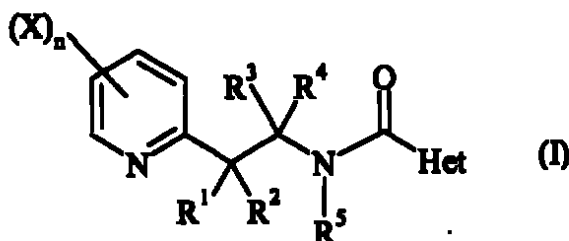
La presente invención se refiere a nuevos derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamidas, su procedimiento de preparación, su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas y métodos para el control de hongos fitopatógenicos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones.

En la solicitud de patente Internacional WO 01/11965 se describe una extensa familia de compuestos fungicidas en que el grupo 2-piridilo está sustituido por al menos un grupo halógenoalquilo.

Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura usar nuevos compuestos pesticidas para evitar o para combatir el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos usados por el agricultor.

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

Según esto, la presente invención se refiere a derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I):



en la cual:

- n es 1, 2, 3 ó 4;

- X es el mismo o diferente y es: un átomo de halógeno, un grupo nitró, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formilo, un grupo formilamino, un grupo carboxilo, un grupo carbamilo, un grupo N-hidroxycarbamilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroximino)-alquilo (C₁-C₈), un alquilo (C₁-C₈), un alqueno (C₂-C₈), un alquino (C₂-C₈), un [alquil (C₁-C₈)]amino, un di[alquil (C₁-C₈)]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halógenoalcoxi C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alqueno (C₂-C₈)]oxi, un halógeno[alqueno (C₂-C₈)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquino (C₂-C₈)]oxi, un halógeno[alquino (C₂-C₈)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halógenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]carbonilo, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]carbonilo con 1 a 5 átomos de

C_6)]sulfinilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfinilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]sulfonilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino, un grupo fenilo, un grupo fenilsulfanilo;

5 o R^1 y R^2 pueden formar juntos: un ciclopropilo, un ciclobutilo, un ciclopentilo o un ciclohexilo;

con la condición de que, cuando tres de los cuatro sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y R^4 sean un átomo de hidrógeno, entonces el cuarto sustituyente no sea un átomo de hidrógeno;

10 - R^5 es: un átomo de hidrógeno, un grupo clavo, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C_1-C_6 , un halógenoalquilo C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C_1-C_6 , un halógenoalcoxi C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C_3-C_6 , un halógenocicloalquilo C_3-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un alquinilo C_2-C_6 , un [alcoxi (C_1-C_6)]-alquilo (C_1-C_6), un clavoalquilo C_1-C_6 , un aminoalquilo C_1-C_6 , un [alquil (C_1-C_6)]amino- alquilo (C_1-C_6), un di[alquil (C_1-C_6)]amino- alquilo (C_1-C_6), un [alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]oxycarbonilo, un [bencil (C_1-C_6)]oxycarbonilo, un [alcoxi (C_1-C_6)]-alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfonilo o un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno;

20 - Het representa heterociclo de 5, 6 ó 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes; estando Het unido por un átomo de carbono y estando al menos sustituido en posición orto;

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

En el contexto de la presente invención:

25 - halógeno significa: flúor, bromo, cloro o yodo;

- heteroátomo significa: N, O o S;

- carboxi significa $-C(=O)OH$;

- carbonilo significa $-C(=O)-$;

- carbamilo significa $-C(=O)NH_2$;

30 - N-hidroxicarbamilo significa $-C(=O)NHOH$;

- un grupo alquilo, un grupo alquenilo y un grupo alquinilo, así como los restos que contienen estas terminologías, pueden ser lineales o ramificados.

En el contexto de la presente invención, se debe también entender que en el caso de radicales amino disustituidos y carbamilo disustituidos, los dos sustituyentes 35 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que se unen un anillo heterocíclico

saturado que contenga de 3 a 7 átomos.

Según la presente invención, el 2-piridilo puede estar sustituido en cualquier posición por $(X)_n$, en que X y n son como se definió anteriormente. Preferiblemente, la presente invención se refiere a derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I), en la que se pueden elegir las diferentes características en solitario o en combinación como:

- por lo que se refiere a n, n es 1, 2 ó 3. Más preferiblemente n es 2 ó 3.
- por lo que se refiere a X, al menos uno de los sustituyentes X es: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_6), un alcoxi (C_1-C_6)imino, un [alcoxi (C_1-C_6)imino]-alquilo (C_1-C_6) o un [alcoxi (C_1-C_6)]-[alquil (C_1-C_6)]carbonilo.
- por lo que se refiere a las posiciones en que el 2-piridilo está sustituido, el 2-piridilo está sustituido en las posiciones 3, 5 y/o en la 6. Más preferiblemente, el 2-piridilo está sustituido en la posición 3 y/o en la 5.

Según la presente invención, los dos átomos de carbono y el átomo de nitrógeno de la "parte etilamido" del compuesto de fórmula (I) están sustituidos respectivamente por R^1 y R^2 , R^3 y R^4 y R^5 , siendo al menos uno de los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y R^4 distintos del hidrógeno. Preferiblemente, la presente invención también se refiere a derivados de la N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I), en los que se pueden elegir las siguientes características solas o en combinación como:

- por lo que se refiere a R^1 y R^2 , R^1 y R^2 se pueden elegir, independientemente uno de otro, como que es: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxil, un grupo: alquilo C_1-C_6 , un halógenoalquilo C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 , un [alquil (C_1-C_6)]sulfenilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfenilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfenilo, un [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino, un [alcoxi (C_1-C_6)]carboniloxil, un [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilamino o un fenilo. Más preferiblemente, R^1 y R^2 se pueden elegir, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_6 , un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno o un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino.

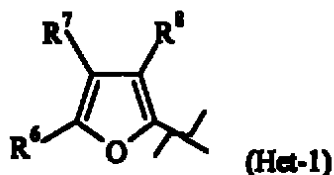
- por lo que se refiere a R^3 y R^4 , R^3 y R^4 se pueden elegir, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C_1-C_6 , un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino o un grupo fenilo. Más preferiblemente, R^3 y R^4 se pueden elegir, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_6 , un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno

o un grupo fenilo;

- por lo que se refiere a R^5 , R^5 se puede elegir para que sea un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo (C_3-C_7).

Según la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo anular de cinco miembros. Los ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de cinco miembros incluyen:

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-1)

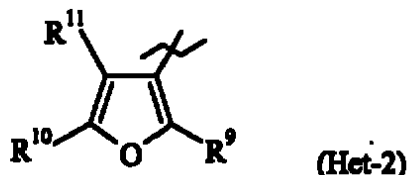


en la cual:

- R^6 y R^7 pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo nitró, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^8 puede ser: un átomo de halógeno, un grupo nitró, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-2)



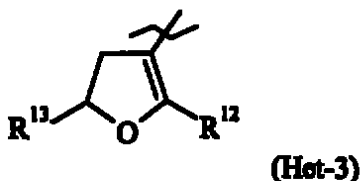
en la cual:

- R^9 puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{10} y R^{11} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno;

con tal de que R^9 y R^{11} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-3)

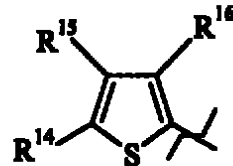


en la que:

- R^{12} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{13} puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

5 * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-4)



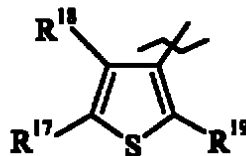
(Het-4)

en la que:

10 - R^{14} y R^{15} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_4)]-tio, un [alquil (C_1-C_4)]-sulfonilo, un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un piridilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un grupo alquilo (C_1-C_4) y

15 - R^{16} puede ser: un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un halógenoalcoxi (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-5)



(Het-5)

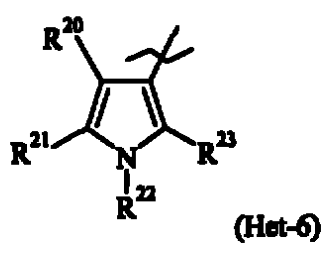
en la que:

20 - R^{17} y R^{18} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un [alquil (C_1-C_4)]-oxi o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{19} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno;

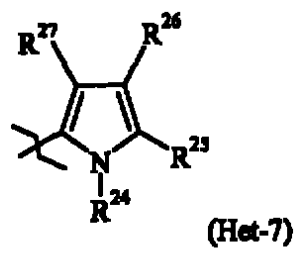
con tal de que R^{17} y R^{18} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

25 * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-6)



en la que:

- R²⁰ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;
- R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y
- R²² puede ser: un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxil (C₁-C₄)]-alquilo (C₁-C₄), un hidroxialquilo (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-sulfonilo, un di[alquil (C₁-C₄)]-aminosulfonilo, un [alquil (C₁-C₆)]-carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un bencillo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄);
- con tal de que R²⁰ y R²³ no sean ambos un átomo de hidrógeno.
- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-7)

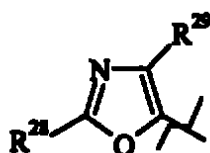


en la que:

- R²⁴ puede ser: un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), un hidroxialquilo (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-sulfonilo, un di[alquil (C₁-C₄)]-aminosulfonilo, un [alquil (C₁-C₆)]-carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un bencillo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) y
- R²⁵, R²⁶ y R²⁷ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno o un [alquil (C₁-C₄)]-carbonilo;

con tal de que R^{24} y R^{27} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-8)

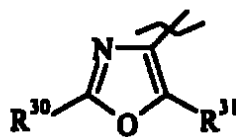


(Het-8)

en la que:

- 5
- R^{28} puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4) y
 - R^{29} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_4 o un halógenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-9)

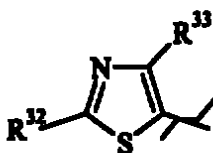


(Het-9)

en la que:

- 10
- R^{30} puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4) y
 - R^{31} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4).

15 * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-10)

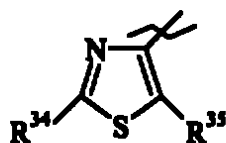


(Het-10)

en la que:

- 20
- R^{32} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo clavo, un [alquil (C_1-C_4)]-amino un di[alquil (C_1-C_4)]-amino, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) y
 - R^{33} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-11)



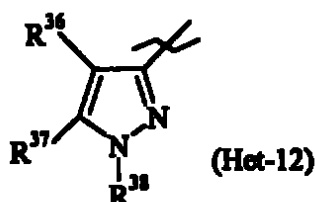
(Het-11)

en la que:

- R³⁴ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un [alquil (C₁-C₄)]-amino, un di[alquil (C₁-C₄)]-amino, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R³⁵ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-12)



(Het-12)

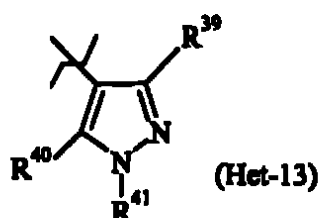
en la que:

- R³⁶ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitró, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C₃-C₆), un alcoxi (C₁-C₄), un halógenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halógeno[alquil (C₁-C₄)]-tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo (C₁-C₄);

- R³⁷ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitró, un alquilo (C₁-C₄), un alcoxi (C₁-C₄) o un [alquil (C₁-C₄)]tio y

- R³⁸ puede ser: un átomo de hidrógeno, un fenilo, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C₁-C₄), un alquenilo (C₂-C₆), un cicloalquilo (C₃-C₆), un [alquil (C₁-C₄)]tioalquilo (C₁-C₄), un halógeno[alquil (C₁-C₄)]-tio-alquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi (C₁-C₄)]alquilo (C₁-C₄) o un halógeno[alcoxi (C₁-C₄)]alquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-13)



en la cual:

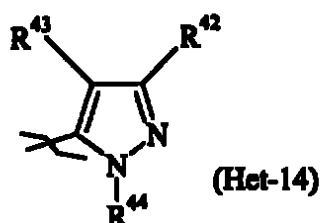
- R^{39} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitró, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un alcoxi (C_1-C_4), un halógenoalcoxi (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_4)]-tio, un halógeno[alquil (C_1-C_4)]-tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo (C_1-C_4);

- R^{40} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxi (C_1-C_4), un halógenoalcoxi (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un [alquil (C_1-C_4)]-tio y

- R^{41} puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquenilo (C_2-C_6), un cicloalquilo (C_3-C_6), [alquil (C_1-C_4)]tioalquilo (C_1-C_4), un halógeno[alquil (C_1-C_4)]tioalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), un halógeno[alcoxi (C_1-C_4)]alquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxialquilo (C_1-C_4) o un grupo nitró;

con tal de que R^{39} y R^{40} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-14)



en la que:

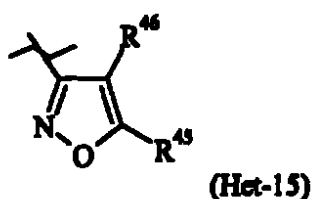
- R^{42} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitró, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un alcoxi (C_1-C_4), un halógenoalcoxi (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_4)]tio, un halógeno[alquil (C_1-C_4)]tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo (C_1-C_4);

- R^{43} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxi (C_1-C_4), un [alquil (C_1-C_4)]-tio o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{44} puede ser: un átomo de hidrógeno, un fenilo, un bencilo, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquenilo (C_2-C_6), un cicloalquilo (C_3-C_6), un [alquil (C_1-C_4)]tioalquilo (C_1-C_4), un halógeno[alquil (C_1-C_4)]tioalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi (C_1-C_4)]-alquilo (C_1-C_4), un halógeno[alcoxi (C_1-C_4)]alquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno;

con tal de que R^{43} y R^{44} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-15)

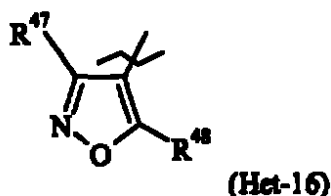


en la cual:

- R^{45} puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{46} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo $C-C_4$ o un halógenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

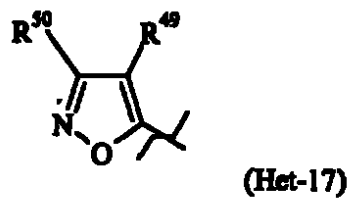
* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-16)



en la que R^{47} y R^{48} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un heterociclilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4);

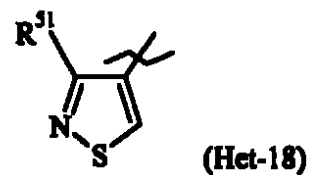
con tal de que R^{47} y R^{48} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-17)

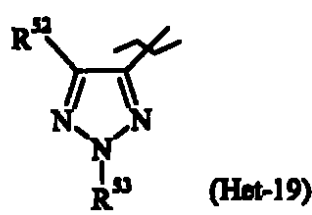


en la cual:

- R⁴⁹ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y
- R⁵⁰ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.
- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-18)

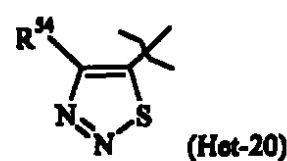


- en la que R⁵¹ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.
- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-19)



en la cual:

- R⁵² puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y
- R⁵³ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄).
- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-20)

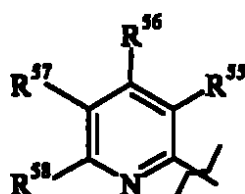


en la que R⁵⁴ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un

halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

Según la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo anular de seis miembros. Los ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de seis miembros incluyen:

- 5 * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-21)



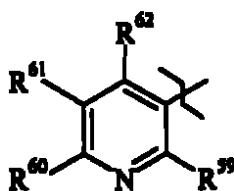
(Het-21)

en la que:

- 10 - R³⁶ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]tio, un halógeno[alquil (C₁-C₄)]tio con 1 a 5 átomos de halógeno o un halógenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- 15 - R³⁷, R³⁸ y R³⁹, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]tio, un halógenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]sulfinilo o un [alquil (C₁-C₄)]sulfonilo.

- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-22)



(Het-22)

en la que:

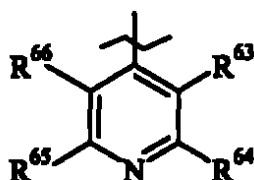
- 20 - R⁵⁹ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]tio, un [alquenoil (C₂-C₃)]tio, un halógeno[alquil (C₁-C₄)]tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un halógenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un fenilitio opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄);

- 25 - R⁶⁰, R⁶¹ y R⁶², que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser: un átomo de

hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo clano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halógenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfinilo, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfonilo o un N-morfolino opcionalmente sustituido por un
5 átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un tienilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄);

con tal de que R⁶³ y R⁶² no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-23)

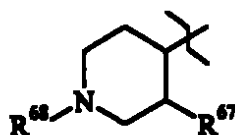


(Het-23)

10 en la que R⁶³, R⁶⁴, R⁶⁵ y R⁶⁶, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo clano, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]tio, un halógeno[alquil (C₁-C₄)]tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un halógenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfinilo o un [alquil (C₁-C₄)]sulfonilo;
15

con tal de que R⁶³ y R⁶⁶ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-24)



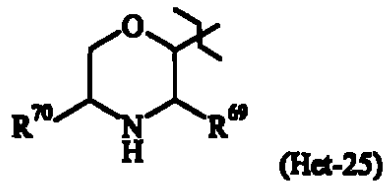
(Het-24)

en la que:

20 - R⁶⁷ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R⁶⁸ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halógenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi (C₁-C₄)]-carbonilo, un bencilo opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno, un benciloxycarbonilo
25 opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno o un heterociclilo.

* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-25)

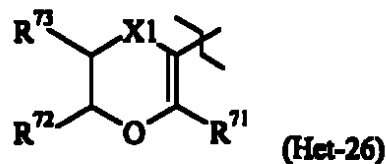


en la que:

- R^{69} puede ser: un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un [alquil (C_1-C_4)]ilo, un halógeno[alquil (C_1-C_4)]ilo con 1 a 5 átomos de halógeno o un halógenoalcoxi (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R^{70} puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_4), un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un bencilo.

- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-26)



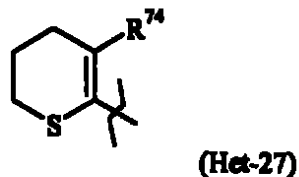
en la que:

- X^1 puede ser: un átomo de azufre, $-SO-$, $-SO_2-$ ó $-CH_2-$;

- R^{71} puede ser: un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{72} y R^{73} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4).

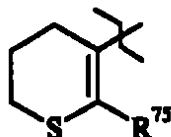
- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-27)



en la que:

- R^{74} puede ser un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

- * Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-28)

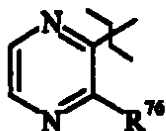


(Het-28)

en la que:

- R^{75} puede ser un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

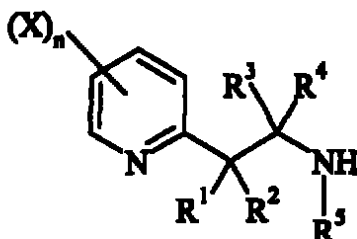
* Het puede representar un heterociclo de la fórmula general (Het-29)



(Het-29)

en la que R^{76} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halógenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, según un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I) como se definió anteriormente, que comprende hacer reaccionar un derivado de la 2-piridina de fórmula general (II) o una de sus sales:



(II)

en que: X, n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se definió anteriormente; con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III)



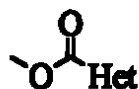
(III)

en la cual:

- Het es como se definió anteriormente y

- L^2 es un grupo saliente, elegido para que sea: un átomo de halógeno, un

grupo hidroxilo, $-OR^{77}$, $-OCOR^{77}$, siendo R^{77} : un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:

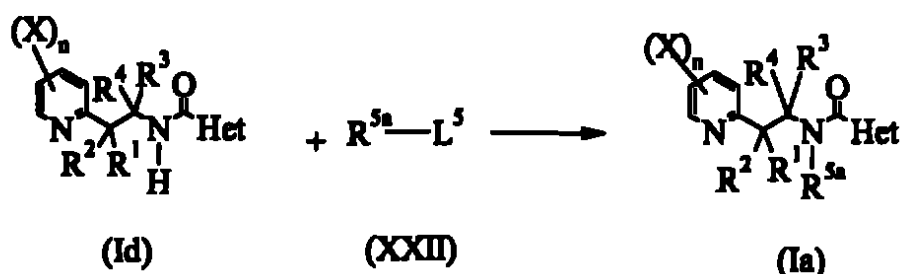


5 en presencia de un catalizador y, si L^2 es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

El procedimiento según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. El catalizador adecuado se puede elegir para que sea: 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

10 En el caso de que L^2 sea un grupo hidroxilo, el procedimiento según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. El agente de condensación adecuado se puede elegir para que sea formador de haluro de ácido, tal como: fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; formador de anhídrido, tal como: cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como: N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensadores habituales, tales como: pentóxido de fósforo, poli(ácido fosfórico), N,N'-carbonil-dimidazol, 2-etoxi-N-etoxycarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, hidrato de cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfonio.

20 Cuando R^6 es un átomo de hidrógeno, el procedimiento mencionado anteriormente para la preparación de compuesto de fórmula general (I) puede completarse opcionalmente mediante una etapa adicional según el siguiente esquema de reacción:



25

en el que: - R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X, n y Het son como se definió anteriormente;

- R^{5a} es: un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C_1-C_6 , un haloalcoxi C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C_3-C_6 , un

halógenocicloalquilo C_3-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un alquinilo C_2-C_6 , un [alcoxi (C_1-C_6)]alquilo (C_1-C_6), un cianoalquilo C_1-C_6 , un aminoalquilo C_1-C_6 , un [alquil (C_1-C_6)]aminoalquilo (C_1-C_6), un di[alquil (C_1-C_6)]aminoalquilo (C_1-C_6), un [alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un halógeno[alquilo (C_1-C_6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]oxicarbonilo, un [bencil (C_1-C_6)]oxicarbonilo, un [alcoxi (C_1-C_6)]alquil (C_1-C_6)carbonilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfonilo o un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno y

- L^5 es un grupo saliente que se elige para que sea: un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfonilo o un metilsulfonilo;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Id) con un compuesto de fórmula general (XXII) para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ia).

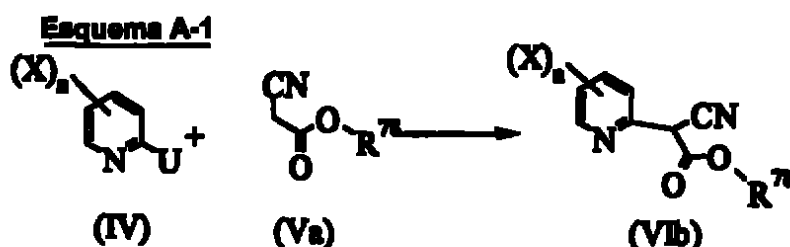
Dependiendo de la definición de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 o R^5 , pueden prepararse derivados de aminas de fórmula general (II) por diferentes procedimientos. Un ejemplo

(A) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

- X, n son como se definió anteriormente;
- R^1 es un alquilo (C_1-C_6);
- R^2 es un átomo de hidrógeno o un alquilo C_1-C_6 y
- R^3 , R^4 y R^5 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar según un procedimiento que comprende:

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



en el que: - X y n son como se definió anteriormente;

- R^n es: un alquilo (C^1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

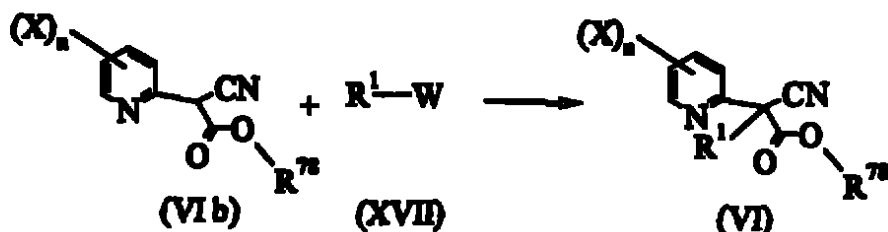
-U es un grupo saliente elegido para que sea: halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]-sulfonato o un [haloalquil (C_1-C_6)]-sulfonato;

que comprende la arilación de un derivado de clanoacetato de fórmula general (Va) por un derivado de piridina de fórmula general (IV), para proporcionar un 2-(piridil)clanoacetatoderivado de fórmula general (VI b), en presencia de una base, a

una temperatura de desde 0°C a 200°C;

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

Esquema A-2



en el que: - X, n son como se definió anteriormente;

5

- R¹ es un alquilo (C₁-C₆);

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

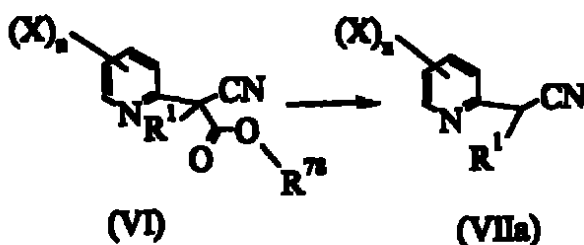
-W es: un átomo de halógeno, un [alquil (C₁-C₆)]sulfonato, un halo[alquil (C₁-C₆)]sulfonato o un 4-metilfenilsulfonato;

10

que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (VI b) por un reactivo de fórmula general (XVII) para proporcionar un compuesto de fórmula general (VI);

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

Esquema A-3



15

en el que: - X, n son como se definió anteriormente;

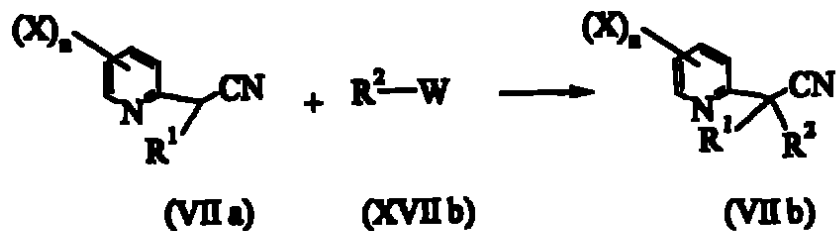
- R¹ es un alquilo (C₁-C₆);

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

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

Esquema A-4



en el que: - X, n son como se definió anteriormente;

- R¹ es un alquilo (C₁-C₆);

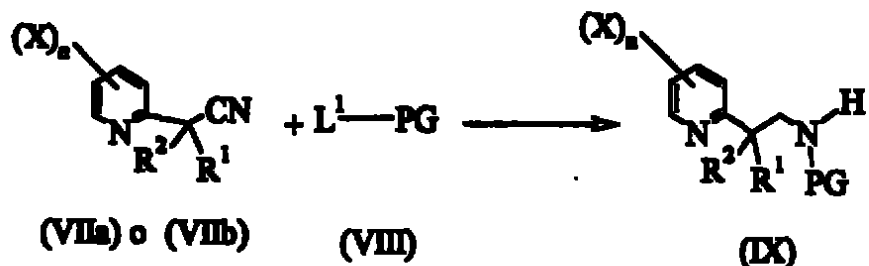
- R² es un alquilo C₁-C₆;

-W es: un átomo de halógeno, un [alquil (C₁-C₆)]-sulfonato, un halo[alquil (C₁-C₆)]-sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato;

que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (VII a) por un reactivo de fórmula general (XVII b) para proporcionar un compuesto de fórmula general (VII b);

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

Esquema A-5



en el que: - X, n son como se definió anteriormente;

- R¹ es un alquilo (C₁-C₆);

- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆;

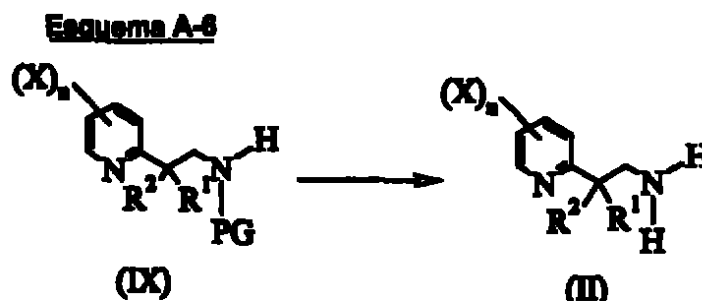
- L¹ es un grupo saliente elegido para que sea un grupo -OR⁷⁷ o un grupo -OCOR⁷⁷, siendo R⁷⁷ un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁷⁷ o un grupo -COR⁷⁷, siendo R⁷⁷: un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIa) o (VIIb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), para producir un compuesto de fórmula general (IX), a una temperatura de 0°C a 150°C y a una presión

desde 10^6 Pa a 10^7 Pa (1 bar a 100 bares);

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



en el que: - X, n son como se definió anteriormente;

- R^1 es un alquilo (C_1-C_6);

- R^2 es un átomo de hidrógeno o un alquilo C_1-C_6

- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR''$ o un grupo $-COR''$, siendo R'' : un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o en uno básico, de un compuesto de fórmula general (IX), para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

La primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo en presencia de una base. Preferiblemente, la base se elegirá para que sea una base inorgánica o una orgánica.

Ejemplos adecuados de tales bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o hidrógenocarbonatos, acetatos o aminas terciarias, de metales alcalinotérreos o de metales alcalinos.

La primera etapa (etapa A-1) 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) según la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. Preferiblemente, el disolvente se elige que sea: agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Los disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, disolvente alifático, alicíclico o aromático.

La primera etapa (etapa A-1) según la presente invención se puede llevar a cabo también en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige para que sea una sal o un complejo de paladio. Más preferiblemente, el catalizador se elige para que sea un complejo de paladio. Un catalizador de complejo de paladio adecuado se puede generar, 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 arañas, voluminosos, tales como: (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etilidifenilfosfina y su enantiómero correspondiente o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etiliditerc-butilfosfina y su enantiómero correspondiente o una mezcla de ambos o (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente o una mezcla de ambos;

La quinta etapa (etapa A-5) según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un donador de hidruro. Preferiblemente, el donador de hidruro se elige para que sea hidruros de metales o de metaloides tales como: LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

La quinta etapa (etapa A-5) según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige para que sea Cloruro-Co(II), cloruro-Ni(II), amoníaco o una de sus sales, paladio sobre carbón vegetal, Níquel Raney, Cobalto Raney o Platino.

La quinta etapa (etapa A-5) según la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de desde 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 quinta etapa (etapa A-5) según la presente invención se lleva a cabo a una presión de desde 10^5 Pa a 10^7 Pa (1 bar a 100 bar). Preferiblemente, la presión es de 10^5 Pa a 5×10^6 Pa (1 bar a 50 bar).

La quinta etapa (etapa A-5) según la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferiblemente, el disolvente se elige para que sea: éter, alcohol, ácido carboxílico, o una mezcla de los mismos con agua o agua pura.

Un segundo ejemplo (B) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

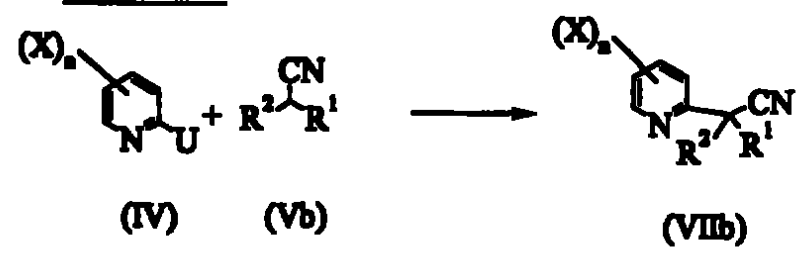
- R^1 , R^2 , X y n son como se definió anteriormente y

- R^3 , R^4 y R^5 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar según un procedimiento que comprende:

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

Esquema B-1



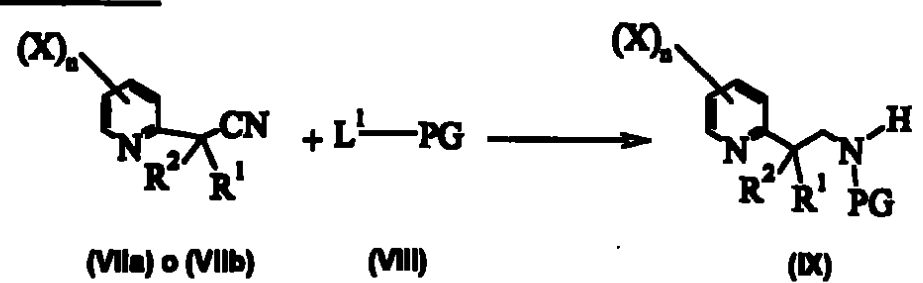
en el que: -R¹, R², X y n son como se definió anteriormente;

- U es un grupo saliente elegido para que sea: un átomo de halógeno, un [alquil (C₁-C₆)]-sulfonato o un halo[alquil (C₁-C₆)]-sulfonato;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (Vb) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para proporcionar un derivado de 2-piridilacetoneitrilo de fórmula general (VIIb), en presencia de una base y a una temperatura de -100°C a 200°C;

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

Esquema B-2



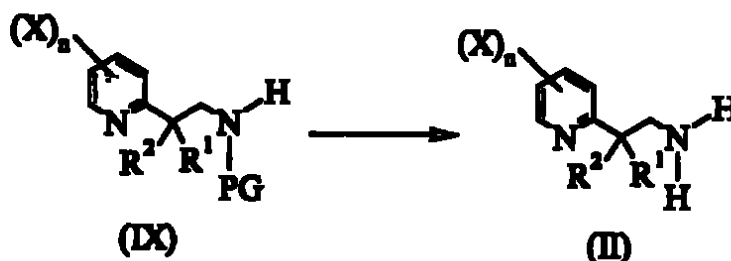
en el que: -R¹, R², X y n son como se definió anteriormente;

- L¹ es un grupo saliente elegido para que sea un grupo -OR^{7b} o un grupo -OCOR^{7b}, siendo R^{7b} un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR^{7b} o un grupo -COR^{7b}, siendo R^{7b} un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIa) o (VIIb), en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), para producir un compuesto de fórmula general (IX);

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

Esquema B-3

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

- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-\text{COOR}^{\text{79}}$ o un grupo $-\text{COR}^{\text{79}}$, siendo R^{79} un alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), un haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o en uno básico, de un compuesto de fórmula general (IX), para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

La primera etapa (etapa B-1) 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 .

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

La primera etapa (etapa B-1) según la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. Preferiblemente, el disolvente se elige para que sea: 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 B-1) según la presente invención se puede llevar a cabo también en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige para que sea una sal o complejo de paladio. Más preferiblemente, el catalizador se elige para que sea un complejo de paladio. Un catalizador de 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-
 etildiciclohexilfosfina 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-
 5 terc-butilfosfina y su enantiómero correspondiente o una mezcla de ambos o (R)-(-)-
 1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente
 o una mezcla de ambos.

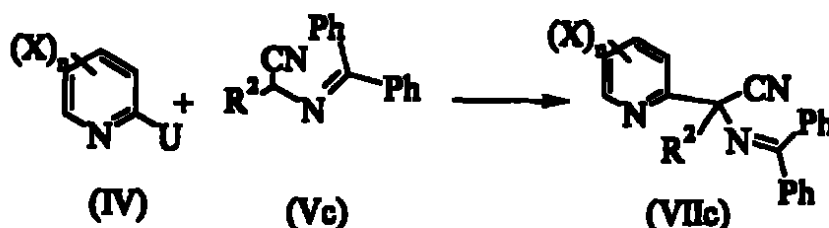
Las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa B-2 son las
 mismas que las condiciones preferidas en las que se lleva a cabo la etapa A-4 del
 10 procedimiento A mencionado anteriormente.

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

Un tercer ejemplo (C) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

- 15 - R^2 , X, n son como se definió anteriormente;
 - R^1 es: un formilamino, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino, un halógeno[alquil
 (C_1-C_6)]carbonilamino con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilcarbonilamino o un 2,6-
 diclorofenilcarbonilamino y
 - R^3 , R^4 y R^5 son átomos de hidrógeno;
 20 entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar
 según un procedimiento que comprende:
 - una primera etapa según el esquema de reacción C-1:

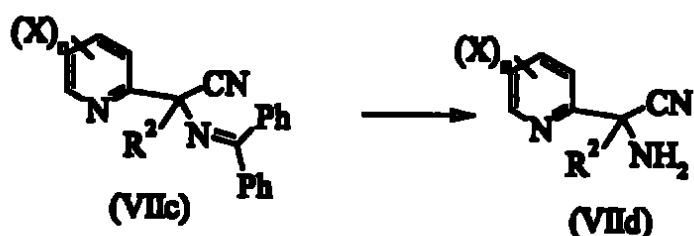
Esquema C-1



- en el que: - R^2 , X, n son como se definió anteriormente;
 25 - U es un grupo saliente elegido para que sea: un átomo de
 halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]sulfonato o un halo[alquil (C_1-C_6)]sulfonato;
 que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (Vc) mediante
 un derivado de piridina de fórmula general (IV), para proporcionar un derivado de 2-
 piridilacetónitrilo de fórmula general (VIIc), en presencia de una base y a una
 30 temperatura de -100°C a 200°C ;

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

Esquema C-2

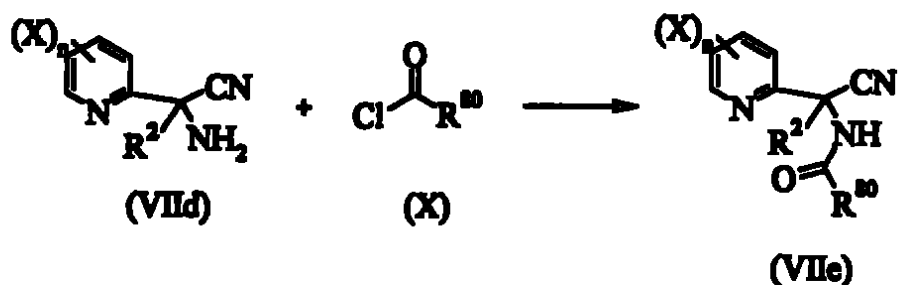


en que R^2 , X, n son como se definió anteriormente;

- que comprende la desprotección, mediante hidrólisis ácida, de un compuesto de fórmula general (VIIc), para producir un compuesto de fórmula general (VIIId) o una de sus sales;

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

Esquema C-3



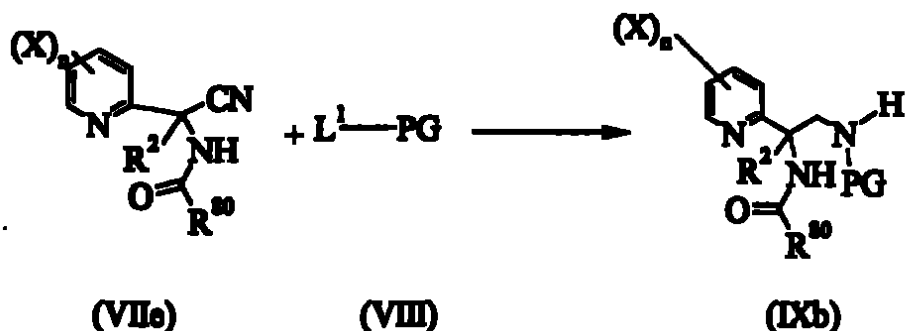
en el que: - R^2 , X, n son como se definió anteriormente;

- R^{80} es: un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_1-C_8), un halógenoalquilo (C_1-C_8) con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo o 2,6-diclorofenilo;

que comprende el acoplamiento entre un compuesto de fórmula general (VIIId) y un cloruro de acilo de fórmula general (X) para producir un compuesto de fórmula general (VIIe).

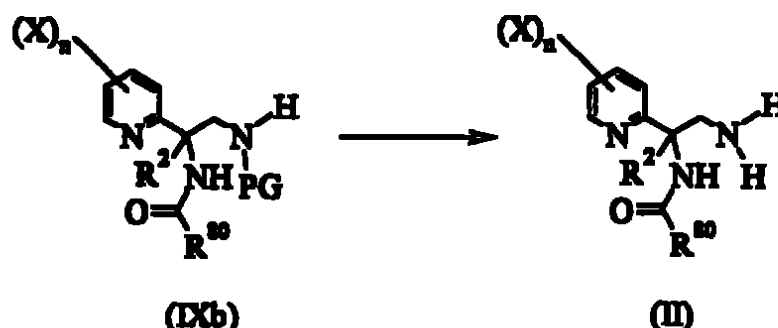
- una cuarta etapa según el esquema de reacción C-4:

Esquema C-4



- en el que:
- R^2 , X, n son como se definió anteriormente;
 - R^{80} es: un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo o 2,6-diclorofenilo;
 - L^1 es un grupo saliente elegido para que sea un grupo $-OR^{79}$ o un grupo $-OCOR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
 - GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- que comprende la reducción, por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIe), en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII) para producir un compuesto de fórmula general (IXb);
- una quinta etapa según el esquema de reacción C-5:

Esquema C-5



- en el que:
- R^2 , X, n son como se definió anteriormente;
 - R^{80} es: un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo o 2,6-diclorofenilo;
 - L^1 es un grupo saliente elegido para que sea un grupo $-OR^{79}$ o un grupo $-OCOR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
 - GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o un grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o en uno básico, de un compuesto de fórmula general (IXb), para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

Un cuarto ejemplo (D) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

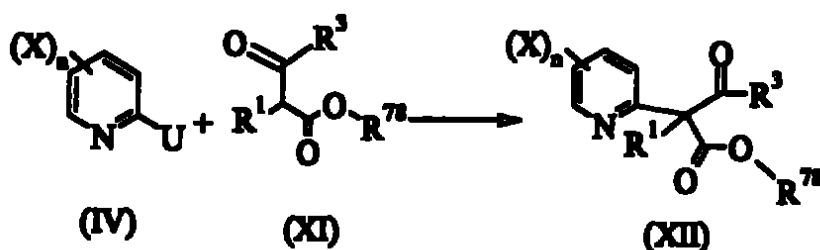
- R^1 , X, Y, n y p son como se definió anteriormente;

- R^2 es un átomo de hidrógeno;
- R^3 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo o un fenilo y
- R^5 es: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un alcoxil (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

5 entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar según un procedimiento que comprende:

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

Esquema D-1



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

10 - R^3 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo o un fenilo;

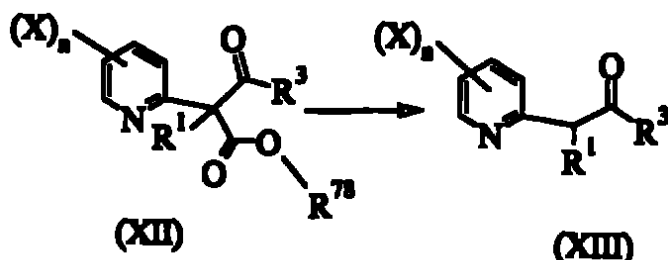
- R^{78} es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

15 -U es un grupo saliente elegido para que sea: un halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]-sulfonato o un halo[alquil (C_1-C_6)]-sulfonato;

que comprende la arilación de un derivado de cetoacetato de fórmula general (XI) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para proporcionar un derivado de 2-(piridil)cetoacetato de fórmula general (XII), en presencia de una base, a una temperatura de 0°C a 200°C ;

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

Esquema D-2



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

- R^2 es un átomo de hidrógeno;

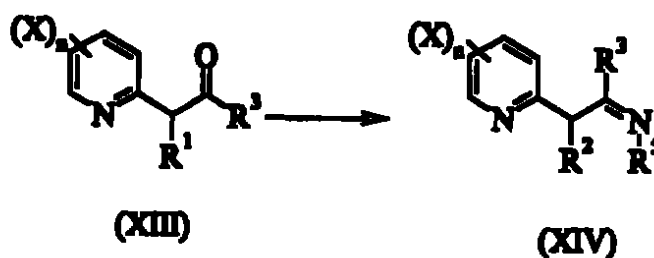
- R^3 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo o un fenilo;

- R_7 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

5 que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento mediante un haluro de un compuesto de fórmula general (XII), en el mismo recipiente o en otro para proporcionar, después de calentar a una temperatura de 40°C a reflujo, un derivado de 2-piridilcetona de fórmula general (XIII);

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

Esquema D-3



10

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

- R^2 es un átomo de hidrógeno;

- R^3 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo o un fenilo;

15

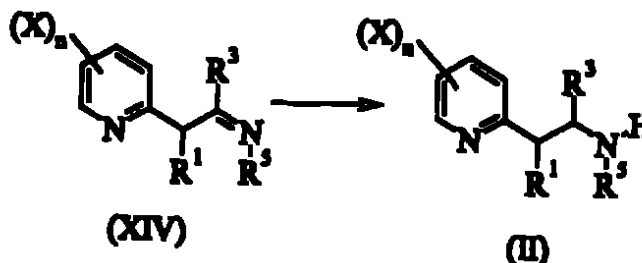
- R^5 es: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un alcoxi (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (XIII) con una amina de fórmula R^5-NH_2 , para proporcionar un derivado de imina de fórmula general (XIV);

20

- una cuarta etapa según el esquema D-4:

Esquema D-4



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

- R^2 es un átomo de hidrógeno;

- R^3 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, un fenilo;

- R^5 es: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un alcoxi (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

que comprende la reducción de un derivado de imina de fórmula general (XIV) por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, en el mismo recipiente o en otro, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

Un quinto ejemplo (E) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

- R^1 , R^2 , X, Y, n y p son como se definió anteriormente;

- R^3 es un átomo de hidrógeno;

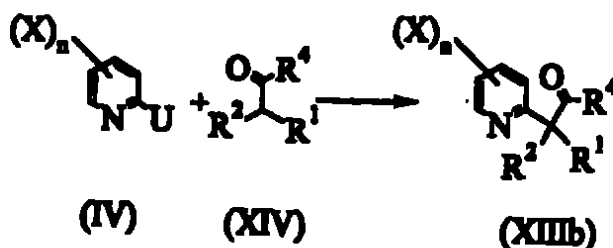
- R^4 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, un fenilo y

- R^5 es: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un alcoxi (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar según un procedimiento que comprende:

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

Esquema E-1



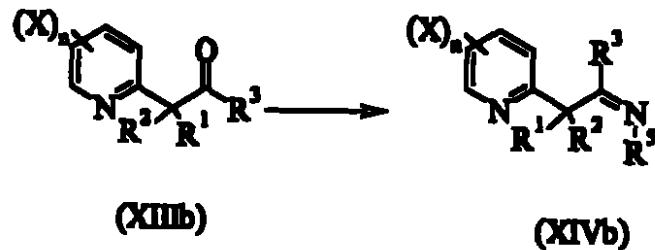
en el que: - R^1 , R^2 , X y n son como se definió anteriormente;

- R^4 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo o un fenilo;

- U es un grupo saliente elegido para que sea: un halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]-sulfonato o un halo[alquil (C_1-C_6)]-sulfonato;

que comprende la arilación de un derivado de cetona de fórmula general (XIV) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para proporcionar un derivado de 2-(piridil)-cetona de fórmula general (XIIIb), en presencia de una base, a una temperatura de 0°C a 200°C;

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

Esquema E-2

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

- R⁴ es: un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo o un

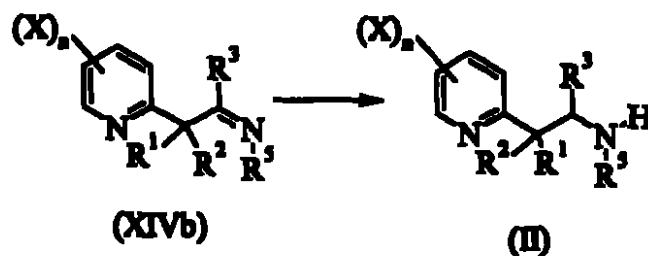
5 fenilo;

- R⁵ es: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un alcoxi (C₁-C₆) o un cicloalquilo (C₃-C₇);

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (XIIIb) con una amina de fórmula R⁵-NH₂, para proporcionar un derivado de imina de fórmula

10 general (XIVb);

- una tercera etapa según el esquema E-3:

Esquema E-3

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

- R³ es: un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo o un

15 fenilo;

- R⁴ es un átomo de hidrógeno;

- R⁵ es: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un alcoxi (C₁-C₆) o un cicloalquilo (C₃-C₇);

que comprende la reducción de un derivado de imina de fórmula general (XIVb), por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, en el mismo recipiente o en otro, para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

20

Un sexto ejemplo (F) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

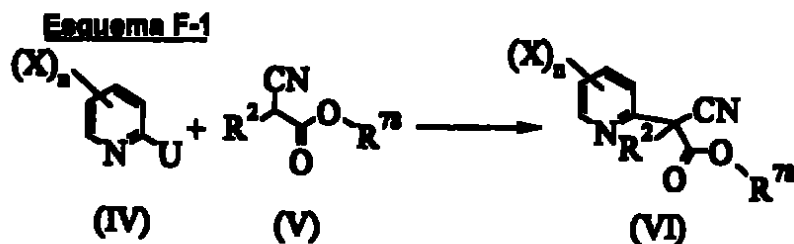
- R^2 , X, n son como se definió anteriormente;

- R^1 es: un grupo clavo, un grupo hidroxilo, un alquínilo (C_2-C_6), un [alquil (C_1-C_6)]amino, un di[alquil (C_1-C_6)]amino, un alcoxi (C_1-C_6), un halógenoalcoxi (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil (C_2-C_6)]oxi, un halógeno[alquenil (C_2-C_6)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquínil (C_3-C_6)]oxi, un halógeno[alquínil (C_3-C_6)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un [alquil (C_1-C_6)]carboniloxi, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^3 y R^4 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar según un procedimiento que comprende:

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



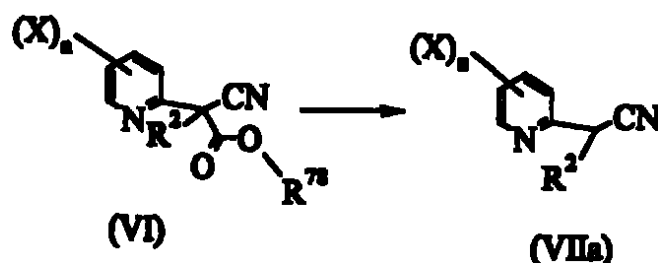
en el que: - R^2 , X y n son como se definió anteriormente;

- R^n es: un alquilo (C^1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

-U es un grupo saliente elegido para que sea: un halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]-sulfonato o un halo[alquil (C_1-C_6)]-sulfonato;

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

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

Esquema F-2

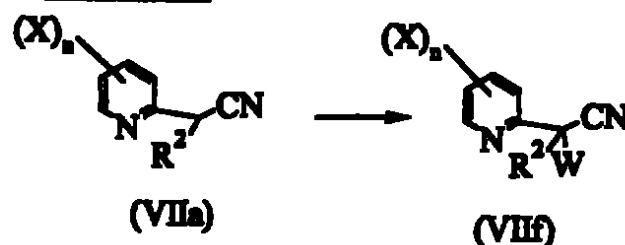
- en el que:
- R^2 , X, n son como se definió anteriormente;
 - R^1 es un átomo de hidrógeno;
 - R^7 es: un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

5

que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento mediante un haluro de un compuesto de fórmula general (VI), en el mismo recipiente o en otro para proporcionar, después de calentar a una temperatura de 40°C a reflujo, un derivado de 2-piridilacetónitrilo de fórmula general (VIIa);

10

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

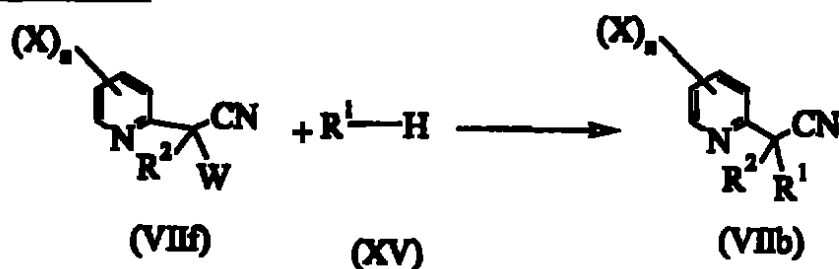
Esquema F-3

- en el que:
- R^2 , X, n son como se definió anteriormente;
 - W es un átomo de halógeno;

15

que comprende la halogenación de un compuesto de fórmula general (VIIa) para proporcionar un compuesto de fórmula general (VIIf);

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

Esquema F-4

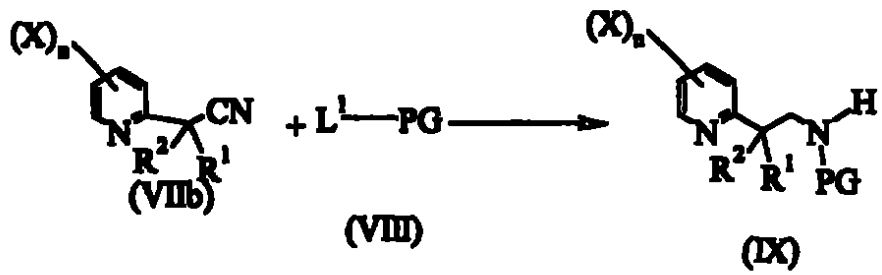
- en el que:
- R^2 , X, n son como se definió anteriormente;

- W es un átomo de halógeno;
- R¹ es: un grupo clano, un grupo hidroxil, un alquilnilo (C₂-C₆), un [alquil (C₁-C₆)]amino, un di[alquil (C₁-C₆)]amino, un alcoxi (C₁-C₆), un halógenoalcoxi (C₁-C₆) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₆)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C₁-C₆)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil (C₂-C₆)]-oxi, un halógeno[alquenil (C₂-C₆)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil (C₃-C₆)]oxi, un halógeno[alquinil (C₃-C₆)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un [alquil (C₁-C₆)]carboniloxi o un halógeno[alquil (C₁-C₆)]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno;

que comprende la sustitución nucleófila, en presencia de una base, de un compuesto de fórmula general (VII) en presencia de un compuesto de fórmula general (XV), para producir un compuesto de fórmula general (VIIb), a una temperatura de -78°C a 150°C;

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

Esquema F-5



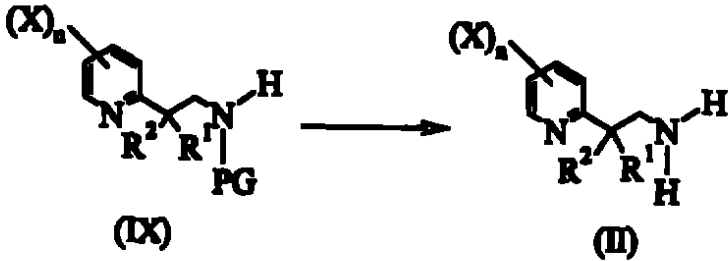
- en el que:
- R², X, n son como se definió anteriormente;
 - R¹ es: un grupo clano, un grupo hidroxil, un alquilnilo (C₂-C₆), un [alquil (C₁-C₆)]amino, un di[alquil (C₁-C₆)]amino, un alcoxi (C₁-C₆), un halógenoalcoxi (C₁-C₆) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₆)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C₁-C₆)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil (C₂-C₆)]-oxi, un halógeno[alquenil (C₂-C₆)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil (C₃-C₆)]oxi, un halógeno[alquinil (C₃-C₆)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un [alquil (C₁-C₆)]carboniloxi o un halógeno[alquil (C₁-C₆)]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno;
 - L¹ es un grupo saliente elegido para que sea un grupo -OR^{7b} o un grupo -OCOR^{7b}, siendo R^{7b}: un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR^{7b} o un grupo -COR^{7b}, siendo R^{7b}: un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), para producir un compuesto de fórmula general (IX), a una temperatura de 0°C a 150°C y a una presión de 10⁵ Pa a 10⁷ Pa (1 bar a 100 bares);

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

Esquema F-6



en el que: - R², X, n son como se definió anteriormente;

- R¹ es: un grupo clavo, un grupo hidroxil, un alquilnilo (C₂-C₆), un [alquil (C₁-C₆)]amino, un di[alquil (C₁-C₆)]amino, un alcoxi (C₁-C₆), un halógenoalcoxi (C₁-C₆) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₆)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C₁-C₆)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil (C₂-C₆)]oxi, un halógeno[alquenil (C₂-C₆)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquilnilil (C₃-C₆)]oxi, un halógeno[alquilnilil (C₃-C₆)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un [alquil (C₁-C₆)]carboniloxi o un halógeno[alquil (C₁-C₆)]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno;

- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR^{7b} o grupo -COR^{7b}, siendo R^{7b}: 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 en uno básico, de un compuesto de fórmula general (IX), para proporcionar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

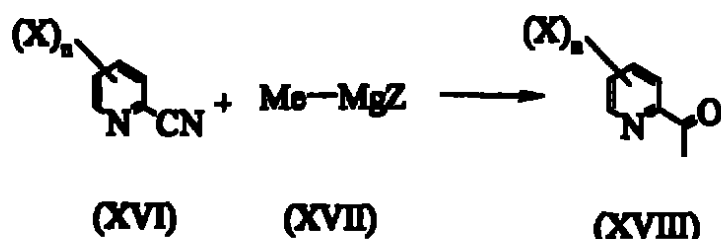
Un séptimo ejemplo (G) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

- X, n son como se definió anteriormente;
- R¹ es un grupo hidroxil y
- R³, R² y R⁴ son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar según un procedimiento que comprende:

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

Esquema G-1



5

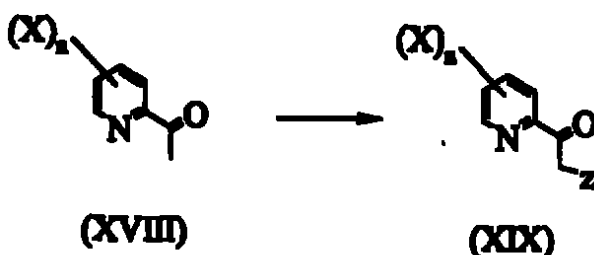
- en el que:
- X y n son como se definió anteriormente;
 - Z es un átomo de halógeno;

que comprende la adición de un halogenuro de metilmagnesio de fórmula general (XVII) a un derivado de piridina de fórmula general (XVI), para proporcionar un compuesto de fórmula general (XVIII);

10

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

Esquema G-2

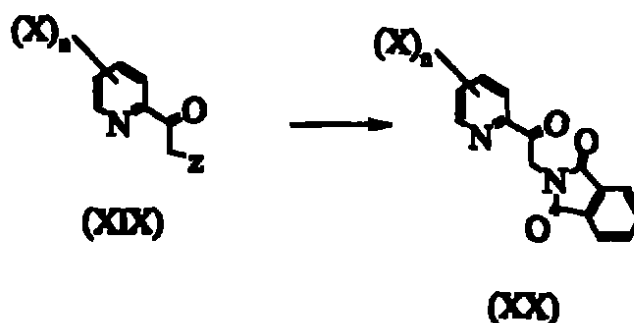


- en el que:
- X y n son como se definió anteriormente;
 - Z es un átomo de halógeno;

que comprende la halogenación de un compuesto de fórmula general (XVIII) para dar un compuesto de fórmula general (XIX) mediante el uso de un agente halogenante, tal como: cloro, bromo, iones hipoclorito, iones hipobromito, iones tricloruro, iones tribromuro, N-cloroimidaz, N-cloroamidas, N-cloroaminas, N-bromoimidaz, N-bromoamidas o N-bromoaminas;

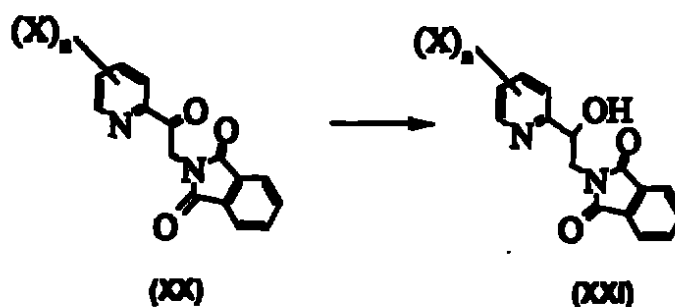
20

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

Esquema G-3

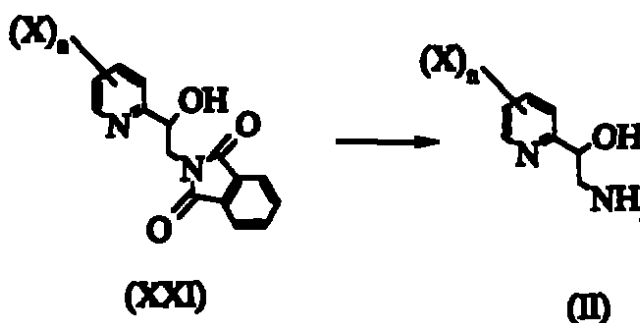
en el que: - X y n son como se definió anteriormente;
 - Z es un átomo de halógeno;

- 5 que comprende la sustitución nucleófila de un compuesto de fórmula general (XIX) por una sal de ftalimida, para producir un compuesto de fórmula general (XX);
 - una cuarta etapa según el esquema de reacción G-4:

Esquema G-4

en que X y n son como se definió anteriormente;

- 10 que comprende la reducción de un compuesto de fórmula general (XX) mediante un donador de hidruro para producir un compuesto de fórmula general (XXI);
 - una quinta etapa según el esquema de reacción G-5:

Esquema G-5

en que X y n son como se definió anteriormente;

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

5 Los compuestos según la presente invención pueden prepararse según los procedimientos descritos anteriormente. Deberá entenderse sin embargo que, en base a su conocimiento general y a las publicaciones disponibles, el experto en la técnica será capaz de adaptar estos procedimientos a las características de cada uno de los compuestos que se desea sintetizar.

10 La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). Así, según 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 definió anteriormente y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

15 En la presente memoria descriptiva, la terminología "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. Los ejemplos de
20 soportes adecuados incluyen: arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales y derivados de los mismos. También se pueden utilizar mezclas de tales soportes.

25 La composición 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. Se puede hacer mención, por ejemplo, a sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes
30 grasos o ácidos grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos descritos anteriormente que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al
35 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.

5 Opcionalmente, también pueden incluirse otros componentes, por ejemplo, coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizantes, 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.

10 En general, la composición según la invención puede contener de 0,05 a 99% (en peso) de material activo, preferiblemente, de 10 a 70% en peso.

Las composiciones según la presente invención se pueden usar en diversas formas como difusor de aerosol, suspensión en cápsula, concentrado de nebulización en frío, polvo, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado autosuspensible para 15 tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, gránulos, concentrado de nebulización en caliente, macrogránulos, microgránulos, polvo dispersable en aceite, concentrado autosuspensible miscible con aceite, líquido miscible con aceite, pasta, varilla vegetal, polvo para tratamiento en seco de semillas, semillas recubiertas con un plaguicida, concentrado soluble, polvo soluble, disolución 20 para tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado autosuspensible), líquido de volumen ultra bajo (ulv), suspensión de volumen ultra bajo (ulv), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de lodos, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo mojable.

25 Estas composiciones incluyen no sólo composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla que se tenga que 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.

30 Los compuestos de la invención pueden mezclarse también con uno o más insecticidas, fungicidas, bactericidas, acaricidas atrayentes 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.

Las composiciones fungicidas de la presente invención se pueden usar para 35 combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatogénicos de los cultivos. Así,

según otro aspecto de la presente invención, se proporciona un método para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatogénicos de cultivos, caracterizado porque se aplica una composición fungicida como se ha descrito anteriormente en la presente memoria a la semilla, a la planta y/o al fruto de la planta o al
5 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 fitopatogénicos de los cultivos comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula general (I).

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

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

El método de tratamiento según la presente invención es útil para tratar material de propagación como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plantas de semillero o plantas de semillero trasplantadas y plantas o plantas que se trasplantan.
20 Este método de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El método de tratamiento según 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 cuestión.

Entre las plantas que se pueden proteger por el método según la invención, se
25 pueden mencionar el algodón; lino; 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), *Ribesoidae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, bananos y
30 plátanos), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp. y *Rutaceae* sp. (por ejemplo: limones, naranjas y pomelos); cultivos de leguminosas tales como *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); grandes cultivos, tales como
35 *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* sp. (por ejemplo, patatas) y *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

5 Entre las plantas y las posibles enfermedades de estas plantas protegidas por el método según la presente invención, deben mencionarse:

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

- trigo, 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*, *Tapesia acutiformis*), mal del pie (*Gaeumannomyces graminis*), tizón del pie (*F. culmorum*, *F. graminearum*), manchas negras (*Rhizoctonia cerealis*), oidio (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), royas (*Puccinia striiformis* y *Puccinia recondita*) y septoriosis (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*);
15

- 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
20 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
25 reticulares (*Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), oidio (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), roya enana (*Puccinia hordei*) y escaldadura de la cebada (*Rhynchosporium secalis*);

- patata, en lo referente a la lucha contra enfermedades de los tubérculos (en particular *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*)
30 y 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: calda de almáciga y podredumbre basal
35 (*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 blight*, *Mycosphaerella pinodes*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*), moho gris (*Botrytis cinerea*) y mildiu (*Peronospora blight*);

- cultivos productores de aceite, por ejemplo, colza, en lo que se refiere a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* y *Sclerotinia sclerotiorum*;

- maíz, en lo que se refiere a la lucha contra las enfermedades de las semillas: (*Rhizopus sp.*, *Penicillium sp.*, *Trichoderma sp.*, *Aspergillus sp.*, y *Gibberella fujikuroi*);

- lino, en lo que se refiere 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 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.*);

- 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 fulginea* y *Leveillula taurica*), fusaria (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), manchas de las hojas (*Cladosporium sp.*), alternaria (*Alternaria sp.*), antracnosis (*Colletotrichum sp.*), septoriosis (*Septoria sp.*), manchas negras (*Rhizoctonia solani*), mildiu (por ejemplo, *Bremia lactucae*, *Peronospora sp.*, *Pseudoperonospora sp.*, *Phytophthora sp.*);

- árboles frutales, en lo referente a enfermedades de las partes aéreas: enfermedades por monilla (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), roña (*Venturia inaequalis*) y oidio (*Podosphaera leucotricha*);

- vid, en lo referente a enfermedades de las hojas: en particular moho gris (*Botrytis cinerea*), oidio (*Uncinula necator*), roña negra (*Guignardia bidwellii*) y mildiu (*Plasmopara viticola*);

- remolacha, en lo referente a combatir las siguientes enfermedades de las

partes aéreas: tizón (*Cercospora beticola*), oidio (*Erysiphe beticola*), manchas de las hojas (*Ramularia beticola*).

La composición fungicida según la presente invención también se puede usar contra enfermedades fúngicas que pueden desarrollarse sobre la madera o en el interior de la misma. La terminología "madera" quiere decir todos los tipos de especies de madera y 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 método para tratar la madera según la invención comprende fundamentalmente ponerla en contacto con uno o más compuestos de la presente invención o una composición según la invención; esto incluye por ejemplo, la aplicación directa, la pulverización, la inmersión, la inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de material activo aplicada normalmente en el tratamiento según la presente invención se encuentra general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferiblemente, entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento de las hojas. La dosis de sustancia activa aplicada está general y ventajosamente entre 2 y 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 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 según la naturaleza del cultivo a tratar.

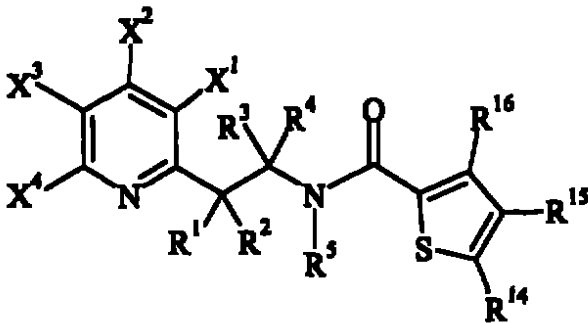
La composición fungicida según la presente invención también se puede usar en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos según la invención o las composiciones agroquímicas según la invención. Las plantas modificadas genéticamente son plantas en cuyo genoma se ha integrado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

La composición según la presente invención se puede usar también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas en humanos y animales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades por *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. Las Tablas siguientes A

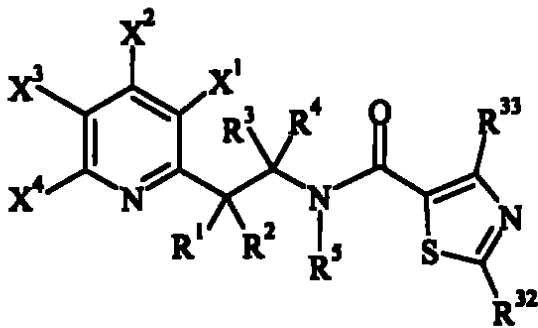
a C ilustra de una manera no limitante ejemplos de compuestos fungicidas según la presente invención. En los siguientes Ejemplos, M+1 (o M-1) quiere decir el pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica) respectivamente, como se observa en espectroscopía de masas y p.f. quiere decir punto de fusión.

Tabla A -



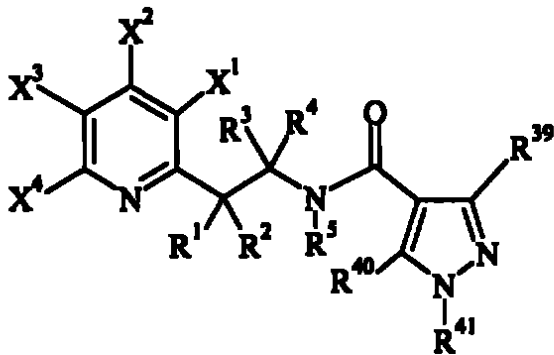
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	M+1	p.f. (°C)
A-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	H	H	I	441 a 1 ³⁵ Cl	-
A-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	I	407 a 1 ³⁵ Cl	-
A-3	H	CO ₂ H	H	H	H	F	H	Cl	F	H	H	I	-	192

Tabla B



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ³²	R ³³	M+1
B-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	Me	CF ₃	398 a 1 ³⁵ Cl
B-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	Me	CF ₃	364 a 1 ³⁵ Cl

5 Tabla C



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	M+1
C-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	381 a 1 ³⁵ Cl
C-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	347 a 1 ³⁵ Cl
C-3	Ciclopentilo		H	H	H	H	H	Cl	H	CHF ₂	H	Me	381 a 1 ³⁵ Cl
C-4	H	Et	H	H	H	H	H	Cl	H	CHF ₂	H	Me	347 a 1 ³⁵ Cl

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

Preparación de N-[2-(5-cloro-2-piridinil)propil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida

5 **Preparación de 2-ciano-2-(5-cloro-2-piridinil)propanoato de *tert*-butilo**

A 150 ml de dimetoxietano se añadió lentamente en pequeñas porciones a 0°C, 11,6 g (0,29 moles) de hidruro de sodio (dispersión al 60% en aceite de parafina). A esta suspensión se añadieron adicionalmente gota a gota, a 5°C, 21,1 g (0,149 moles) de clanoacetato de *tert*-butilo en 50 ml de dimetoxietano. La suspensión se agitó
10 durante 45 min a temperatura ambiente. A la suspensión se añadieron sucesivamente 20 g (0,136 moles) de 2,5-dicloropiridina, 0,73 g (1,36 mmoles) de (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-*tert*-butilfosfina y 1,56 g (2,7 mmoles) de bis(dibencilidenoacetona)paladio(0). La mezcla negra se calentó para hacerla hervir a reflujo durante 4 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añadieron gota
15 a gota 12,7 ml (0,2 moles) de yoduro de metilo y se agitó además la mezcla a temperatura ambiente durante 17 horas. La mezcla de reacción se vertió en 100 ml de ácido clorhídrico 1N y se filtró la fase acuosa 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
20 evaporó el disolvente a presión reducida, para proporcionar 44,56 g del producto bruto como un aceite marrón. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía por desorción súbita sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2) para dar 2-ciano-2-(5-cloro-2-piridinil)propanoato de *tert*-butilo: 23,44 g (64%) como un aceite amarillo.

25 **Espectro de masas: [M+1] = 267.**

Preparación de 2-(5-cloro-2-piridinil)propanonitrilo

A una disolución de 23 g (0,086 moles) de 2-ciano-2-(5-cloro-2-piridinil)propanoato de *tert*-butilo en 150 ml de tolueno, se añadieron 7,4 g (0,043 moles) de ácido *p*-toluenosulfónico monohidratado. La mezcla se agitó durante 1,5
30 horas a 110°C. Después de enfriamiento, la mezcla de reacción se vertió en agua de hielo y se llevó el pH a 8 por adición de hidrogenocarbonato de sodio acuoso.

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 magnesio. El disolvente se evaporó a presión reducida para dar 15,4 g del producto bruto como un aceite naranja. El
35 producto en bruto se purificó mediante cromatografía por desorción súbita sobre gel de

silice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2) para dar 2-(5-cloro-2-piridinil)propanonitrilo: 7,8 g (54%) como un aceite amarillo.

Espectro de masas: $[M+1] = 167$.

Preparación de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilcarbamato de terc-butilo

5 A una disolución de 5,2 g (0,031 moles) de 2-(5-cloro-2-piridinil)propanonitrilo en 60 ml de metanol se añadieron rápidamente 8 g (0,034 moles) de cloruro de cobalto(II) hexahidratado y 13,5 g (0,062 moles) de dicarbonato de di-*tert*-butilo. La disolución oscura se enfrió a -5°C y se añadieron 8,2 g (0,217 moles) de borohidruro de sodio en pequeñas porciones a 0°C . La mezcla de reacción se agitó a temperatura
10 ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se neutralizó por 100 ml de ácido clorhídrico 1 N y se retiró metanol a presión reducida. Se volvió a extraer la fase acuosa por acetato de etilo (2 x 150 ml) y se lavó la fase orgánica con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio.

El disolvente se evaporó a presión reducida para dar 11,7 g del producto bruto
15 como un aceite negro. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía por desorción súbita sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 9/1) para dar 2-(5-cloro-2-piridinil)propilcarbamato de *tert*-butilo: 4,8 g (57%) como un aceite amarillo.

Espectro de masas: $[M+1] = 271$.

20 Preparación de hidrocioruro de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilamina

A una disolución de 4,8 g (0,018 moles) de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilcarbamato de *tert*-butilo en 30 ml de éter dietílico se añadieron 44 ml (0,089 moles) de una disolución de cloruro de hidrógeno 2M en éter dietílico. La mezcla se agitó 3 horas a temperatura ambiente.

25 Se filtró el sólido y se secó durante la noche a vacío para dar hidrocioruro de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilamina: 3,5 g (94%) como un sólido amarillo.

Espectro de masas: $[M+1] = 169$.

Preparación de N-[2-(5-cloro-2-piridinil)propil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida

30 A una suspensión de 100 mg (0,48 mmoles) de hidrocioruro de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilamina en 3 ml de diclorometano se añadieron sucesivamente 240 ml (1,68 mmoles) de trietilamina y 113 mg (0,58 mmoles) de cloruro de 1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carbonilo. La mezcla se agitó 4 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió en agua y se llevó el pH a 4.

35 Se evaporó el disolvente y se purificó el residuo mediante cromatografía por

desorción súbita sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2) para dar N-[2-(5-cloro-2-piridinil)propil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida como un aceite amarillo: 40 mg (24%) como un aceite amarillo.

Espectro de masas: $[M+1] = 347$.

5 **Ejemplos de actividad biológica del compuesto de fórmula general (I)**

Ejemplo A : ensayo *in vivo* sobre *Alternaria brassicae* (Mancha de las hojas de las crucíferas)

El ingrediente activo ensayado se preparó mediante homogeneización de Potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión
10 se diluyó a continuación con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

Las plantas de rábanos (variedad Pernot), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se trataron en el estadio de cotiledón pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

15 Las plantas, usadas como controles, se trataron con una disolución acuosa que no contenía el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminaron pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm³). Las esporas se recogieron de un cultivo de 12-13 días.

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

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

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total a
25 una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: A1.

En estas condiciones, se observó protección buena (al menos 50%) o total a una dosis de 125 ppm con el siguiente compuesto: C4.

Ejemplo B : ensayo *in vivo* sobre *Pyrenophora teres* (Mancha reticular de la cebada)

30 El ingrediente activo ensayado se preparó mediante homogeneización de Potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión se diluyó a continuación con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

35 Las plantas de cebada (variedad Express), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 12°C, se trataron en la etapa de 1

hoja (10 cm de alto), pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, se trataron con una disolución acuosa que no contenía el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminaron pulverizándolas con una
5 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 humedad relativa de 100% y a continuación durante 12 días a humedad relativa de 80%.

La clasificación se llevó a cabo 12 días después de la contaminación, en
10 comparación con las plantas de control.

En estas condiciones, se observó protección buena (al menos 50%) o total a una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: A1, B1, C1, C2 y D1.

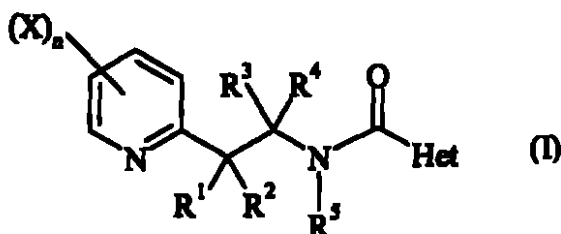
En estas condiciones, se observó protección buena (al menos 50%) o total a una dosis de 125 ppm con el siguiente compuesto: C4.

15 La N-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-4-fenil benzamida descrita en la Solicitud de Patente Internacional WO 01/11965 (véase el compuesto 316 en la Tabla D) mostró una eficacia deficiente sobre la *Alternaria brassicae* y una eficacia nula sobre la *Botrytis cinerea* a 330 ppm; la N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-3-nitrobenzamida
20 descrita también en la Solicitud de Patente Internacional WO 01/11965 (véase el compuesto 307 en la Tabla D) mostró una eficacia deficiente sobre la *Alternaria brassicae* y una eficacia nula sobre la *Botrytis cinerea* a 330 ppm; la N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-benzamida y la N-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-benzamida también descritas en la Solicitud de Patente
25 Internacional WO 01/11965 (véanse los compuestos 304 y 314 en la Tabla D), mostraron una eficacia nula sobre la *Botrytis cinerea* a 330 ppm y la N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-4-clorobenzamida, la N-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-2-bromobenzamida y la N-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-4-metoxibenzamida, también descritas en la
30 solicitud de patente internacional WO 01/11965 (véanse los compuestos 306, 310 y 315 en la Tabla D) mostraron una eficacia nula sobre la *Botrytis cinerea* a 330 ppm.

La N-{[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil}-5-tienilacetamida descrita en la solicitud de patente internacional WO 01/11965 (véase el compuesto 101 en la tabla B) mostró una eficacia deficiente frente a la *Alternaria brassicae* y ninguna eficacia frente
35 a la *Botrytis cinerea* y la *Peronospora parasitica* a 330 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general (I):



5 en la cual:

- n es 1, 2, 3 ó 4;

- X es el mismo o diferente y es: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo clano, un grupo hidroxil, 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 carbamilo, un grupo N-hidroxicarbamilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxilimino)-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 halógenoalcoxi C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil (C₂-C₈)]oxi, un halógeno[alquenil (C₂-C₈)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquínil (C₃-C₈)]oxi, un halógeno[alquínil (C₃-C₈)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halógenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]carbonilo, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]carbamilo, un di[alquil (C₁-C₈)]carbamilo, un N-[alquil (C₁-C₈)]oxicarbamilo, un [alcoxi (C₁-C₈)]carbamilo, un N-[alquil (C₁-C₈)]-[alcoxi (C₁-C₈)]carbamilo, un [alcoxi (C₁-C₈)]carbonilo, un halógeno[alcoxi (C₁-C₈)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]carboniloxi, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]carbonilamino, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]carbonilamino con 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 halógeno[alquil (C₁-C₈)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]sulfinilo, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]sulfinilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₈)]sulfonilo, un halógeno[alquil (C₁-C₈)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi (C₁-C₈)]imino, un [alcoxi (C₁-C₈)]imino]-alquilo (C₁-C₈), un [alquenil (C₁-C₈)]oxidimino]-alquilo (C₁-C₈), un [alquínil (C₁-C₈)]oxidimino]-alquilo (C₁-C₈), un (benciloxiimino)-alquilo (C₁-C₈), un benciloxi, un

bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

- R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son lo mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo clano, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamollo, un grupo N-hidroxycarbamollo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_6 , un alquilo C_1-C_6 , un halógenoalquilo C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un alquinilo C_2-C_6 , un [alquil (C_1-C_6)]amino, un di[alquil (C_1-C_6)]amino, un alcoxi C_1-C_6 , un halógenoalcoxi C_1-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil (C_2-C_6)]oxi, un halógeno[alquenil (C_2-C_6)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil (C_2-C_6)]oxi, un halógeno[alquinil (C_2-C_6)]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C_3-C_6 , un halógenocicloalquilo C_3-C_6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]carbamollo, un di[alquil (C_1-C_6)]carbamollo, un N-[alquil (C_1-C_6)]oxycarbamollo, un [alcoxi (C_1-C_6)]carbamollo, un N-[alquil (C_1-C_6)]-[alcoxi (C_1-C_6)]carbamollo, un [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, un halógeno[alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]carboniloxi, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]carbonilamino con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]aminocarboniloxi, un di[alquil (C_1-C_6)]aminocarboniloxi, un [alquil (C_1-C_6)]oxycarboniloxi, un [alquil (C_1-C_6)]sulfenilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]sulfinilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfinilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]sulfonilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino, un grupo fenilo, un grupo fenilsulfanilo;

o R^1 y R^2 pueden formar juntos: un ciclopropilo, un ciclobutilo, un ciclopentilo o un ciclohexilo;

- con la condición de que, cuando tres de los cuatro sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y R^4 sean un átomo de hidrógeno, entonces el cuarto sustituyente no sea un átomo de hidrógeno;

- R^5 es: un átomo de hidrógeno, un grupo clano, un grupo formilo, un grupo hidroxil, un alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_6), un halógeno[alcoxi (C_1-C_6)] con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un halógenocicloalquilo (C_3-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un

alquenilo C_2-C_6 , un alquinilo C_2-C_6 , un [alcoxi (C_1-C_6)]alquilo (C_1-C_6), un clanoalquilo C_1-C_6 , un aminoalquilo C_1-C_6 , un [alquil (C_1-C_6)]aminoalquilo (C_1-C_6), un di[alquil (C_1-C_6)]aminoalquilo (C_1-C_6), un [alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un halógeno[alquil (C_1-C_6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]oxycarbonilo, un
5 benciloxycarbonilo (C_1-C_6), un [alcoxi (C_1-C_6)]alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfonilo o un halógeno[alquil (C_1-C_6)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno;

- Het representa heterociclo de 5, 6 ó 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes; estando Het unido por un átomo de carbono y estando al menos sustituido en posición orto;

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

2. Un compuesto según la reivindicación 1, caracterizado por que n es 1, 2 ó 3.

3. Un compuesto según la reivindicación 1 ó 2, caracterizado por que al menos uno de los sustituyentes X es: un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_6 , un
15 [alcoxi (C_1-C_6)]imino, un [alcoxi (C_1-C_6)]imino]-alquilo (C_1-C_6) o un [alcoxi (C_1-C_6)]-alquil (C_1-C_6)]carbonilo.

4. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado por que el 2-piridilo está sustituido en la posición 3, 5 y/o en la 6.

5. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4,
20 caracterizado porque R^1 y R^2 se eligen, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo clano, un grupo hidroxí, un alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo (C_2-C_6), un alcoxi (C_1-C_6), un [alquil (C_1-C_6)]sulfanilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfenilo, un [alquil (C_1-C_6)]sulfinilo, un [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino, un [alcoxi (C_1-C_6)]carboniloxi, un [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilamino o un
25 grupo fenilo.

6. Un compuesto según la reivindicación 5, caracterizado por que R^1 y R^2 se eligen, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno o un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino.
30

7. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado por que R^3 y R^4 se eligen, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo clano, un alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilamino o un grupo fenilo.
35

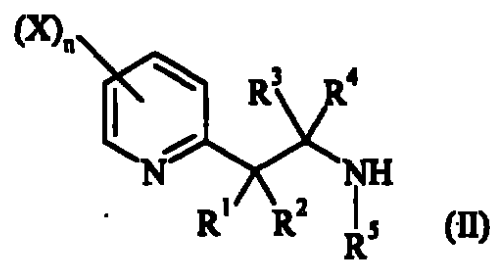
8. Un compuesto según la reivindicación 7, caracterizado por que R^3 y R^4 se eligen, independientemente uno de otro, para que sean: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno o un grupo fenilo.

5 9. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado por que R^5 es un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo (C_3-C_7).

10. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado por que Het es un heterociclo anular de cinco miembros.

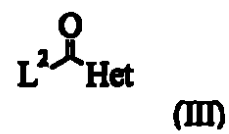
10 11. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado por que Het es un heterociclo anular de seis miembros.

12. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, que comprende hacer reaccionar un derivado de la 2-piridina de fórmula general (II) o una de sus sales:



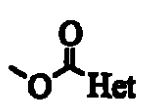
15 en que X, n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como en cualquiera de las reivindicaciones precedentes;

con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III):



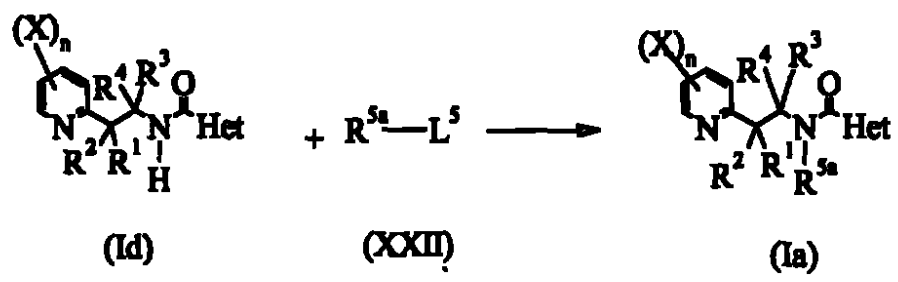
20 en la cual:

- Het es como se definió en cualquiera de las reivindicaciones precedentes y
- L^2 es un grupo saliente elegido para que sea: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OR^6$, $-OCOR^6$, siendo R^6 : un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:



25 en presencia de un catalizador y, si L^2 es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

13. Un procedimiento según la reivindicación 12, caracterizado por que R^5 es un átomo de hidrógeno y por que el procedimiento se completa por una etapa adicional según el siguiente esquema de reacción:



5 en el que: - R^1, R^2, R^3, R^4, X, n y Het son como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15;

- R^{5a} es: un grupo clavo, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo (C_1-C_6), un halógenoalquilo (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_6), un halógenoalcoxi (C_1-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un halógenocicloalquilo (C_3-C_6) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un alquinilo C_2-C_6 , un [alcoxi (C_1-C_6)]alquilo (C_1-C_6), un clavoalquilo C_1-C_6 , un aminoalquilo C_1-C_6 , un [alquilo (C_1-C_6)]aminoalquilo (C_1-C_6), un di[alquilo (C_1-C_6)]aminoalquilo (C_1-C_6), un [alquilo (C_1-C_6)]carbonilo, un halógeno[alquilo (C_1-C_6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquilo (C_1-C_6)]oxycarbonilo, un benciloxycarbonilo (C_1-C_6), un [alcoxi (C_1-C_6)]alquilo (C_1-C_6)carbonilo, un [alquilo (C_1-C_6)]sulfonilo o un halógeno[alquilo (C_1-C_6)]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno y

- L^5 es un grupo saliente elegido para que sea: un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfonilo o un metilsulfonilo;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Id) con un compuesto de fórmula general (XXII) para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ia).

14. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y un soporte aceptable desde el punto de vista agrícola.

25 15. Un método para combatir de forma preventiva o curativa los hongos fitopatógenos de cultivos, caracterizado por que se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición según la reivindicación 14 a las semillas de la planta o a las hojas de la planta y/o a los frutos de las plantas o al suelo en el que están creciendo las plantas o en el que se desea que crezcan.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int'l. Application No
PC1/EP2005/003282

06217

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D409/12 C07D417/12 C07D401/12 A01N43/42 A01N43/78
A01N43/60

91

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, PAJ, EMBASE, 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	WO 99/62901 A (ARCHIBALD SARAH CATHERINE ; CELLTECH THERAPEUTICS LTD (GB); HEAD JOHN) 9 December 1999 (1999-12-09) Example 2	1,2,4,5, 9,10,12
X	WO 01/11965 A (AVENTIS CROPSCIENCE GMBH ; BRIGGS GEOFFREY GOWER (FR); STEELE CHRIS RI) 22 February 2001 (2001-02-22) cited in the application Claims 1-8; Formulae (I) and I(q); Table D; Compounds 101, 111-112, 302, 310, 313, 319, 321, 325-326, 340, 605, 618, 635, 637-641, 644-646, 649-652, 654 -/-	1-15

☒ 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 but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts 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
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

22 June 2005

Date of mailing of the international search report

01/07/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Kirsch, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int'l Application No
PCT/EP2005/003282

00118

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01/05769 A (DOW AGROSCIENCES LLC) 25 January 2001 (2001-01-25) Claims 1-4, 9-11, 16-26; Formula (I); compounds 229-230, 233, 243-244, 246-247, 483, 486-490, 508-512, 518	1-15
X	WO 2004/016088 A (RIECK HEIKO ; LACHAISE HELENE (FR); BAYER CROPSCIENCE SA (FR); COQUERO) 26 February 2004 (2004-02-26) Claims 1-16; examples	1-15
X	EP 0 144 230 A (PFIZER LIMITED; PFIZER CORPORATION) 12 June 1985 (1985-06-12) Claim 6; Formula (VIII); example 4(2)	1-5, 9, 10, 12
P, X	EP 1 449 841 A (BAYER CROPSCIENCE SA) 25 August 2004 (2004-08-25) Claims 1-50; Formula (I); examples; Tables A-V	1-15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int. Application No.
PCT/EP2005/003282

001/9

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9962901	A	09-12-1999	AT 275559 T 15-09-2004
		AU 765979 B2 09-10-2003	
		AU 4156699 A 20-12-1999	
		CA 2331791 A1 09-12-1999	
		DE 69920010 D1 14-10-2004	
		EP 1084119 A1 21-03-2001	
		ES 2228050 T3 01-04-2005	
		WO 9962901 A1 09-12-1999	
		JP 2002517391 T 18-06-2002	
		US 6110945 A 29-08-2000	
		US 6369229 B1 09-04-2002	
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 A 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 0105769	A	25-01-2001	AU 780698 B2 14-04-2005
		AU 6357200 A 05-02-2001	
		BR 0012615 A 30-03-2004	
		CA 2374995 A1 25-01-2001	
		CN 1450993 A 22-10-2003	
		CZ 20020219 A3 16-10-2002	
		EP 1196388 A2 17-04-2002	
		EP 1516874 A1 23-03-2005	
		EP 1516875 A1 23-03-2005	
		HU 0301764 A2 29-09-2003	
		JP 2003528806 T 30-09-2003	
		PL 363114 A1 15-11-2004	
		TR 200200587 T2 21-12-2004	
		WO 0105769 A2 25-01-2001	
		US 2003018052 A1 23-01-2003	
		US 2002177578 A1 28-11-2002	
		US 2003022903 A1 30-01-2003	
		US 2004048864 A1 11-03-2004	
		US 2004034025 A1 19-02-2004	
		US 6521622 B1 18-02-2003	
		ZA 200200436 A 02-03-2004	
WO 2004016088	A	26-02-2004	EP 1389614 A1 18-02-2004
		AU 2003266316 A1 03-03-2004	
		CA 2492173 A1 26-02-2004	
		WO 2004016088 A2 26-02-2004	
		EP 1531673 A2 25-05-2005	
EP 0144230	A	12-06-1985	AT 55393 T 15-08-1990
		CA 1263499 A1 28-11-1989	
		DE 3482942 D1 13-09-1990	
		DK 581684 A 18-06-1985	
		EP 0144230 A2 12-06-1985	
		GR 81149 A1 03-04-1985	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

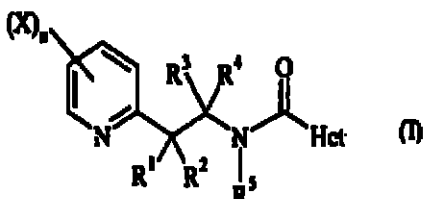
Int. Patent Application No. **00120**
PCT/EP2005/003282

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date	
EP 0144230	A	IE 57648 B1	10-02-1993	
		JP 60155194 A	15-08-1985	
		US 4562197 A	31-12-1985	
EP 1449841	A	25-08-2004	EP 1449841 A1	25-08-2004
		WO 2004074280 A1	02-09-2004	

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT		00121	
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07D 409/12			
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE S.A.			
(30) Prioridad	(31) No. 04358029.1	(32) Fecha 03/03/2004	(33) País EP	(72) Inventor(es) MANSFIELD, Darren James Otros	
				(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ	
(85) Fecha límite inicio fase nacional: 03/10/08				(87) Publicación Internacional	
(88) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT				Fecha: 15/09/2005	
Fecha de presentación de la solicitud: 01/03/2005				N° publicación: WO 2005/085238	
No. de solicitud PCT/EP2005/003282					
(54) Título: DERIVADOS DE 2-PIRIDINILETILCARBOXAMIDA Y SU USO COMO FUNGICIDAS					

Reivindicación(es):

1. Un compuesto de fórmula general (I):



En la cual:

- n es 1, 2, 3 ó 4;
- X es el mismo o diferente y es: un átomo de halógeno, un grupo nitró, un grupo clano, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro—sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxil, un grupo formilamino, un grupo carboxil, un grupo carbamilo, un grupo N-hidroxicarbamilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxilamino)-alquilo (C1-C6), un alquilo (C1-C6), un alquénilo (C2-C6), un alquililo (C2-C6), un [alquil (C1-C6)]amino, un di[alquil (C1-C6)]amino, un alcoxil C1-C6, un halógenoalcoxil C1-C6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]sulfanilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquénil (C2-C6)]oxil, un halógeno[alquénil (C2-C6)]oxil con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquilil (C2-C6)]oxil, un halógeno[alquilil (C2-C6)]oxil con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C3-C6, un halógenocicloalquilo C3-C6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carbonilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carbamilo, un di[alquil (C1-C6)]carbamilo, un N-[alquil (C1-C6)]oxicarbamilo, un [alcoxil (C1-C6)]carbamilo, un N-[alquil (C1-C6)]-[alcoxil (C1-C6)]carbamilo, un [alcoxil (C1-C6)]carbonilo, un halógeno[alcoxil (C1-C6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carboniloxil, un halógeno[alquil (C1-C6)]carboniloxil con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carbonilamino, un halógeno[alquil (C1-C6)]carbonilamino con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]aminocarboniloxil, un di[alquil (C1-C6)]aminocarboniloxil, un [alquil (C1-C6)]oxycarboniloxil, un [alquil (C1-C6)]sulfenilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]sulfenilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxil (C1-C6)], un [alcoxil (C1-C6)]imino-alquilo (C1-C6), un [alquénil (C1-C6)]oxilamino-alquilo (C1-C6), un [alquilil (C1-C6)]oxilamino-alquilo (C1-C6), un (benciloxilamino)-alquilo (C1-C6), un benciloxil, un bencilsulfenilo, un bencilamino, un fenoxil, un fenilsulfenilo o un fenilamina;
- R1, R2, R3 y R4 son lo mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo clano, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxil, un grupo formilamino, un grupo carboxil, un grupo carbamilo, un grupo N-hidroxicarbamilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxilamino)-alquilo C1-C6, un alquilo C1-C6, un halógenoalquilo C1-C6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un alquénilo C2-C6, un alquililo C2-C6, un [alquil (C1-C6)]amino, un di[alquil (C1-C6)]amino, un alcoxil C1-C6, un halógenoalcoxil C1-C6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]sulfenilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquénil (C2-C6)]oxil, un halógeno[alquénil (C2-C6)]oxil con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquilil (C2-C6)]oxil, un halógeno[alquilil (C2-C6)]oxil con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C3-C6, un halógenocicloalquilo C3-C6 con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carbonilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carbamilo, un di[alquil (C1-C6)]carbamilo, un N-[alquil (C1-C6)]oxicarbamilo, un [alcoxil (C1-C6)]carbamilo, un N-[alquil (C1-C6)]-[alcoxil (C1-C6)]carbamilo, un [alcoxil (C1-C6)]carbonilo, un halógeno[alcoxil (C1-C6)]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carboniloxil, un halógeno[alquil (C1-C6)]carboniloxil con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]carbonilamino, un halógeno[alquil (C1-C6)]carbonilamino con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]aminocarboniloxil, un di[alquil (C1-C6)]aminocarboniloxil, un [alquil (C1-C6)]oxycarboniloxil, un [alquil (C1-C6)]sulfenilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C1-C6)]sulfenilo, un halógeno[alquil (C1-C6)]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxil (C1-C6)], un [alcoxil (C1-C6)]imino-alquilo (C1-C6), un [alquénil (C1-C6)]oxilamino-alquilo (C1-C6), un [alquilil (C1-C6)]oxilamino-alquilo (C1-C6), un (benciloxilamino)-alquilo (C1-C6), un benciloxil, un bencilsulfenilo, un bencilamino, un fenoxil, un fenilsulfenilo o un fenilamina, un grupo fenilo, un grupo fenilsulfenilo;
- o R1 y R2 pueden formar juntos: un ciclopropilo, un ciclobutilo, un ciclopentilo o un ciclohexilo;
- con la condición de que , cuando tres de los cuatro sustituyentes R1, R2, R3 y R4 sean un átomo de hidrógeno, entonces el cuarto sustituyente no sea un átomo de hidrógeno;

- R₆ es: un átomo de hidrógeno, un grupo clavo, un grupo formilo, un grupo hidroxil, un alquilo (C₁-C₆), un halógenoalquilo (C₁-C₆) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₆), un halógeno[alcoxi (C₁-C₆)] con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C₂-C₆), un halógenocicloalquilo (C₂-C₆) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno (C₂-C₆), un alquino (C₂-C₆) alquilo (C₁-C₆), un clavoalquilo C₁-C₆, un aminoalquilo C₁-C₆, un [alquilo C₁-C₆)] aminoalquilo (C₁-C₆), un di[alquilo (C₁-C₆)] aminoalquilo (C₁-C₆), un [alquilo (C₁-C₆)] carbonilo, un halógeno[alquilo (C₁-C₆)] carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquilo (C₁-C₆)] oxycarbonilo, un benzyloxycarbonilo (C₁-C₆), un [alcoxi (C₁-C₆)] [alquilo (C₁-C₆)] carbonilo, un [alquilo (C₁-C₆)] sulfonyl o un halógeno[alquilo (C₁-C₆)] sulfonyl con 1 a 5 átomos de halógeno;
- Het representa heterociclo de 5, 6 ó 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes; estando Het unido por un átomo de carbono y estando la menos sustituido en posición orto; así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos y metaloides.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad 06-095699-00000 0000

Fec 2006-09-22 15:41 26 Dep 2020 NUECREACIONES

Tra 11 PATENTEYII

Eve. 378 FASENACIONALI

Act 411 PRESENTACION

Folios 124

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

22 de Sep 2006

96

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

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

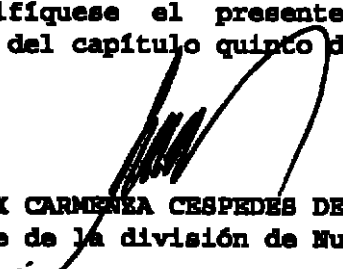
REFERENCIA	Radicación No.	6 95699
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/003282
	Fecha inicio fase nacional	03/10/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	000-14271

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

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

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

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


ALIX CARMEN CESPÉDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 11 DIC. 2006
adpa11