



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 324 883**

51 Int. Cl.:

**C07D 237/12** (2006.01)

**C07D 237/14** (2006.01)

**C07D 307/60** (2006.01)

**A01N 43/58** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05745957 .0**

96 Fecha de presentación : **27.05.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1767529**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **28.03.2007**

54 Título: **Compuesto de piridazina y su utilización.**

30 Prioridad: **09.06.2004 JP 2004-170823**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**18.08.2009**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**18.08.2009**

73 Titular/es: **Sumitomo Chemical Company, Limited**  
**27-1, Shinkawa 2-chome**  
**Chuo-ku, Tokyo 104-8260, JP**

72 Inventor/es: **Morishita, Hiroshi y**  
**Manabe, Akio**

74 Agente: **Curell Suñol, Marcelino**

ES 2 324 883 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

## DESCRIPCIÓN

Compuesto de piridazina y su utilización.

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un compuesto de piridazina, a sus utilidades y a su producto intermedio de producción.

10 **Antecedentes de la técnica**

Convencionalmente se han desarrollado fungicidas agrícolas y se ha descubierto una gran cantidad de compuestos que presentan una actividad fungicida (ver, por ejemplo, las patentes JP nº 56113767 o JP nº 55111472, que dan a conocer derivados de piridazina fungicidas. Sin embargo, un efecto de control de enfermedades de las plantas de estos compuestos no resulta necesariamente suficiente y se están buscando nuevos compuestos que presenten un efecto de control de las enfermedades de las plantas.

**Exposición de la invención**

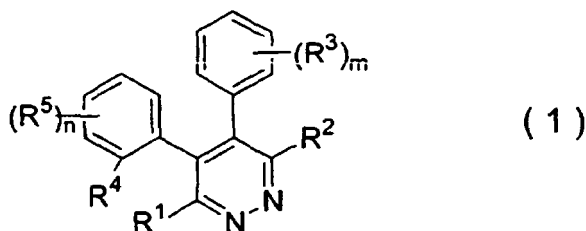
20 Los presentes inventores ha investigado profundamente para encontrar un compuesto que presente un excelente efecto de control de las enfermedades de las plantas, y como resultado han encontrado que un compuesto de piridazina representado por la fórmula (1) siguiente presenta una excelente actividad de control de las enfermedades de las plantas, completando la presente invención.

25 Es decir, la presente invención es tal como se describe en los elementos 1 a 7 siguientes.

1. Un compuesto de piridazina representado por la fórmula (1) (al que se hace referencia en adelante como compuesto de la presente invención):

30

35



40

en la que,

45 R<sup>1</sup> representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>2</sup> representa un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

50 R<sup>3</sup> representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

m representa un número entero entre 0 y 5, con la condición de que, en el caso de que m represente un número entero de 2 ó más, cada R<sup>3</sup> es igual o diferente,

55

R<sup>4</sup> representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

60

R<sup>5</sup> representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

65

n representa un número entero entre 0 y 4, con la condición de que, en el caso de que n represente un número entero de 2 ó más, cada R<sup>5</sup> es igual o diferente.

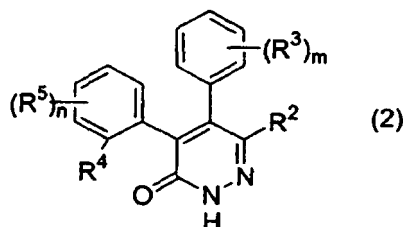
2. Una composición fungicida que comprende el compuesto de la presente invención como ingrediente activo.

## ES 2 324 883 T3

3. Un procedimiento para controlar las enfermedades de las plantas que comprende una etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto de la presente invención en plantas o suelos de cultivo de las plantas.

4. Utilización del compuesto de la presente invención como ingrediente activo de una composición fungicida.

5. Un compuesto representado por la fórmula (2):



en la que,

$R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

$R^3$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

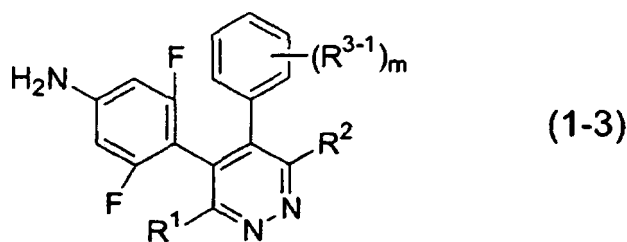
$m$  representa un número entero entre 0 y 5, con la condición de que, en el caso de que  $m$  represente un número entero de 2 ó más, cada  $R^3$  es igual o diferente,

$R^4$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

$R^5$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

$n$  representa un número entero entre 0 y 4, con la condición de que, en el caso de que  $n$  represente un número entero de 2 ó más, cada  $R^5$  es igual o diferente.

6. Un compuesto representado por la fórmula (1-3):



en la que,

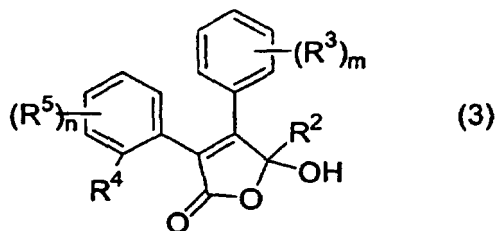
$R^1$  representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$ ,

$R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

$R^{3-1}$  representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

$m$  representa un número entero entre 0 y 5, con la condición de que, en el caso de que  $m$  represente un número entero de 2 ó más, cada  $R^{3-1}$  es igual o diferente.

7. Un compuesto representado por la fórmula (3):



en la que,

15  $R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

$R^3$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

20

$m$  representa un número entero entre 0 y 5, con la condición de que, en el caso de que  $m$  represente un número entero de 2 ó más, cada  $R^3$  es igual o diferente,

$R^4$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

25

$R^5$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

30

$n$  representa un número entero entre 0 y 4, con la condición de que, en el caso de que  $n$  represente un número entero de 2 ó más, cada  $R^5$  es igual o diferente.

35

A continuación se describen sustituyentes en los compuestos de la presente invención y similares.

Como el sustituyente en el compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1), el compuesto representado por la fórmula (2), el compuesto representado por la fórmula (1-3) y el compuesto representado por la fórmula (3) de la presente invención, se ejemplifican los grupos mostrados a continuación.

40

El grupo alcoxi  $C_1-C_4$  representado por  $R^1$  incluye, por ejemplo, un grupo metoxi y un grupo etoxi.

El grupo alquilo  $C_1-C_4$  representado por  $R^2$  incluye, por ejemplo, un grupo metilo y un grupo etilo.

45

El grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno representado por  $R^3$  o  $R^{3-1}$  incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo terc-butilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo y un grupo fluorometilo;

el grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo isopropoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo fluorometoxi, un grupo clorodifluorometoxi, un grupo bromodifluorometoxi, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi y un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi;

50

el grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno incluye, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo trifluorometiltio y un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio y

55

el átomo de halógeno representado por  $R^3$ ,  $R^{3-1}$ ,  $R^4$  y  $R^5$  incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

60

El grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno representado por  $R^4$  y  $R^5$  incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo y un grupo fluorometilo,

65

y el grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo difluorometoxi y un grupo fluorometoxi.

## ES 2 324 883 T3

El grupo fenilo sustituido con  $R^4$  y  $(R^5)_n$  incluye, por ejemplo, grupos en los que n es 0, es decir, un grupo 2-clorofenilo, un grupo 2-fluorofenilo, un grupo 2-nitrofenilo, un grupo 2-cianofenilo, un grupo 2-metilfenilo, un grupo 2-(trifluorometil)fenilo, un grupo 2-metoxifenilo, un grupo 2-(difluorometoxi)fenilo, un grupo 2-(trifluorometoxi)fenilo; grupos en los que n es 1, es decir, un grupo 2,3-difluorofenilo, un grupo 2,3-diclorofenilo, un grupo 2,4-difluorofenilo, un grupo 2-cloro-4-fluorofenilo, un grupo 4-cloro-2-fluorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, un grupo 2,5-difluorofenilo, un grupo 2,6-difluorofenilo, un grupo 2-cloro-6-fluorofenilo, un grupo 2,6-diclorofenilo, un grupo 2-fluoro-6-metilfenilo, un grupo 2-fluoro-6-nitrofenilo, un grupo 2-ciano-6-fluorofenilo, un grupo 2-fluoro-6-(trifluorometil)fenilo, un grupo 2-(difluorometoxi)-6-fluorofenilo, un grupo 2-fluoro-6-(trifluorometoxi)fenilo, un grupo 2-fluoro-6-metoxifenilo; grupos en los que n es 2, es decir, un grupo 2,3,4-trifluorofenilo, un grupo 2,3,5-trifluorofenilo, un grupo 2,4,5-trifluorofenilo, un grupo 2,3,6-trifluorofenilo, un grupo 2,4,6-trifluorofenilo, un grupo 2-cloro-4,6-difluorofenilo, un grupo 4-cloro-2,6-difluorofenilo, un grupo 2,6-difluoro-4-etoxifenilo, un grupo 2,6-difluoro-4-metoxifenilo, un grupo 2,4-dicloro-6-fluorofenilo, un grupo 2,6-dicloro-4-fluorofenilo, un grupo 2,4,6-triclorofenilo, un grupo 2,6-difluoro-4-cianofenilo, un grupo 2,6-difluoro-4-nitrofenilo, un grupo 2,6-difluoro-4-(trifluorometil)fenilo, un grupo 2,3-difluoro-6-(trifluorometil)fenilo, un grupo 2,6-difluoro-3-clorofenilo; grupos en los que n es 3, es decir, un grupo 2,3,4,5-tetrafluorofenilo, un grupo 2,3,4,6-tetrafluorofenilo, un grupo 2,3,5,6-tetrafluorofenilo; grupos en los que n es 4, es decir, un grupo 2,3,4,5,6-pentafluorofenilo, un grupo 4-metoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo, un grupo 4-etoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo, un grupo 4-ciano-2,3,5,6-tetrafluorofenilo, un grupo 4-nitro-2,3,5,6-tetrafluorofenilo y un grupo 4-cloro-2,3,5,6-tetrafluorofenilo.

El grupo fenilo sustituido con  $(R^3)_m$  incluye, por ejemplo, un grupo fenilo; grupos en los que m es 1, es decir, un grupo 4-metilfenilo, un grupo 3-metilfenilo, un grupo 2-metilfenilo, un grupo 4-etilfenilo, un grupo 4-isopropilfenilo, un grupo 4-terc-butilfenilo, un grupo 4-(trifluorometil)fenilo, un grupo 3-(trifluorometil)fenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 3-clorofenilo, un grupo 2-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 3-fluorofenilo, un grupo 2-fluorofenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 3-metoxifenilo, un grupo 4-etoxifenilo, un grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo, un grupo 4-nitrofenilo, un grupo 4-cianofenilo, un grupo 4-(metiltio)fenilo, un grupo 4-(trifluorometiltio)fenilo; grupos en los que m es 2, es decir, un grupo 2,4-dimetilfenilo, un grupo 2,5-dimetilfenilo, un grupo 3,4-dimetilfenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, un grupo 2,5-diclorofenilo, un grupo 3,4-diclorofenilo, un grupo 2,3-difluorofenilo, un grupo 2,4-difluorofenilo, un grupo 2,5-difluorofenilo, un grupo 3,4-difluorofenilo, un grupo 3,5-difluorofenilo, un grupo 4-cloro-2-fluorofenilo, un grupo 2,4-dimetoxifenilo y un grupo 3,4-dimetoxifenilo.

Entre las formas de realización del compuesto de la presente invención se incluyen, por ejemplo, los compuestos siguientes en los compuestos de la presente invención.

Compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^1$  es un átomo de cloro o un átomo de bromo;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^1$  es un grupo alcoxi  $C_1-C_4$ ;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^1$  es un átomo de cloro y  $R^2$  es un grupo metilo;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^1$  es un grupo metoxi y  $R^2$  es un grupo metilo;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^3$  es un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, o un átomo de halógeno;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^3$  es un grupo alquilo  $C_1-C_4$  o un átomo de halógeno;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^3$  es un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un átomo de cloro, un átomo de flúor o un grupo metoxi;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que  $R^3$  es un grupo metilo, un átomo de cloro o un átomo de flúor;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1 ó 2;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 2;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1 y  $R^3$  es un sustituyente en la posición 4 del anillo de benceno;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1,  $R^3$  es un átomo de halógeno, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, y  $R^3$  es un sustituyente en la posición 4 del anillo de benceno;

compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1,  $R^3$  es un átomo de halógeno o un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, y  $R^3$  es un sustituyente en la posición 4 del anillo de benceno;

## ES 2 324 883 T3

- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1, R<sup>3</sup> es un átomo de halógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y R<sup>3</sup> es un sustituyente en la posición 4 del anillo de benceno;
- 5 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1, R<sup>3</sup> es un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un átomo de cloro, un átomo de flúor o un grupo metoxi, y R<sup>3</sup> es un sustituyente en la posición 4 del anillo de benceno;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1, R<sup>3</sup> es un grupo metilo, un átomo de cloro o un átomo de flúor, y R<sup>3</sup> es un sustituyente en la posición 4 del anillo de benceno;
- 10 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que R<sup>4</sup> es un átomo de flúor;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que R<sup>4</sup> es un átomo de cloro;
- 15 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que R<sup>4</sup> es un átomo de flúor o un átomo de cloro;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 0, 1 ó 2;
- 20 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 0;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 1;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 2;
- 25 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 1 ó 2 y R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 1, R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- 30 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 2, R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 1, R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- 35 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 2, R<sup>5</sup> es un átomo de flúor, y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- 40 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno, n es 1 ó 2 y R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 1, R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno, R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- 45 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 2, R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno, R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno, y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 1, R<sup>4</sup> es un átomo de flúor, R<sup>5</sup> es un átomo de flúor, y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- 50 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que n es 2, R<sup>4</sup> es un átomo de flúor, R<sup>5</sup> es un átomo de flúor y R<sup>5</sup> es un sustituyente en la posición 4 ó 6 del anillo de benceno;
- 55 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1 ó 2, y n es 0, 1 ó 2;
- compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que R<sup>1</sup> es un átomo de cloro o un átomo de bromo, R<sup>2</sup> es un grupo metilo y R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno, y
- 60 compuestos de piridazina de fórmula (1) en la que m es 1 ó 2, n es 0, 1 ó 2, R<sup>1</sup> es un átomo de cloro o un átomo de bromo, R<sup>2</sup> es un grupo metilo y R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno.
- Entre las formas de realización del compuestos representado por la fórmula (2), el compuesto representado por la fórmula (1-3) y el compuesto representado por la fórmula (3), que son productos intermedios del compuesto de la presente invención, se incluyen, por ejemplo, los compuestos indicados posteriormente.
- 65

## ES 2 324 883 T3

Entre las formas de realización del compuesto representado por la fórmula (2) se incluyen, por ejemplo, los compuestos indicados a continuación.

Compuestos de fórmula (2) en la que  $m$  es 1 ó 2, y  $n$  es 0, 1 ó 2;

compuestos de fórmula (2) en la que  $R^2$  es un grupo metilo y  $R^4$  es un átomo de halógeno, y

compuestos de fórmula (2) en la que  $m$  es 1 ó 2,  $n$  es 0, 1 ó 2,  $R^2$  es un grupo metilo y  $R^4$  es un átomo de halógeno.

Entre las formas de realización del compuesto representado por la fórmula (1-3) se incluyen, por ejemplo, los compuestos siguientes.

Compuestos de fórmula (1-3) en la que  $m$  es 1 ó 2;

compuestos de fórmula (1-3) en la que  $R^1$  es un átomo de cloro o un átomo de bromo,  $R^2$  es un grupo metilo y  $R^4$  es un átomo de halógeno, y

compuestos de fórmula (1-3) en la que  $m$  es 1 ó 2,  $R^1$  es un átomo de cloro o un átomo de bromo,  $R^2$  es un grupo metilo y  $R^4$  es un átomo de halógeno.

Entre las formas de realización del compuesto representado por la fórmula (3) se incluyen, por ejemplo, los compuestos siguientes.

Compuestos de fórmula (3) en la que  $m$  es 1 ó 2, y  $n$  es 0, 1 ó 2;

compuestos de fórmula (3) en la que  $R^2$  es un grupo metilo, y  $R^4$  es un átomo de halógeno, y

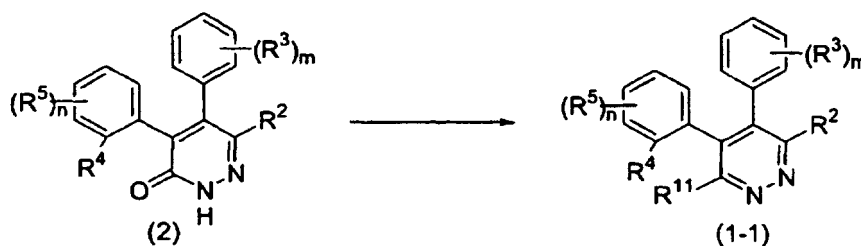
compuestos de fórmula (3) en la que  $m$  es 1 ó 2,  $n$  es 0, 1 ó 2,  $R^2$  es un grupo metilo y  $R^4$  es un átomo de halógeno.

A continuación, se describe el procedimiento para producir el compuesto de la presente invención.

El compuesto de la presente invención puede producirse, por ejemplo, mediante los siguientes Procedimientos de producción 1, 2 y 3.

### Procedimiento de producción 1

El compuesto representado por la fórmula (1-1) en la que  $R^1$  es un átomo de cloro o un átomo de bromo, de entre los compuestos de la presente invención, puede producirse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (2) con un agente halogenante.



(en las que,

$R^2$  es un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

$R^3$  es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

$m$  es un número entero entre 0 y 5, con la condición de que, en el caso de que  $m$  sea un

número entero de 2 ó más, cada  $R^3$  es igual o diferente,

## ES 2 324 883 T3

R<sup>4</sup> es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

R<sup>5</sup> es un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno,

n es un número entero entre 0 y 4, con la condición de que, en el caso de que n sea un número entero de 2 ó más, cada R<sup>5</sup> es igual o diferente.

R<sup>11</sup> es un átomo de cloro o un átomo de bromo).

La reacción se lleva a cabo en ausencia o en presencia de un solvente.

Entre los ejemplos del solvente utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos tales como tolueno, xileno y similares, hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno y similares, y mezclas de los mismos.

El agente halogenante utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, agentes clorantes, tales como oxiclorigenato de fósforo, pentaclorigenato de fósforo y agentes bromantes, tales como oxibromuro de fósforo, pentabromuro de fósforo y similares.

La cantidad del agente halogenante utilizada en la reacción habitualmente es una proporción de 1 a 20 molar por cada mol del compuesto representado por la fórmula (2).

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida entre 20°C y 120°C, y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido entre 0,1 y 8 horas.

Tras completar la reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se somete a una operación posterior al tratamiento, tal como la concentración de la mezcla de reacción, la adición de agua al residuo y la extracción con un solvente orgánico, y el secado de la capa orgánica resultante, la concentración y similares; de esta manera puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (1-1). El compuesto representado por la fórmula (1-1) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similares.

### Procedimiento de producción 2

El compuesto representado por la fórmula (1-2) en la que R<sup>1</sup> es un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, de entre los compuestos de la presente invención, puede producirse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (1-1) con un compuesto alcoholato representado por la fórmula siguiente:



(en la que R<sup>12</sup> es un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).



(en las que R<sup>11</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, m, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, n y R<sup>12</sup> presentan los mismos significados que se han proporcionado anteriormente).

La reacción se lleva a cabo habitualmente en un solvente.

Entre los ejemplos del solvente utilizado en la reacción se incluyen los alcoholes representados por la fórmula R<sup>12</sup>H, éteres tales como tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano y similares, y mezclas de los mismos.

## ES 2 324 883 T3

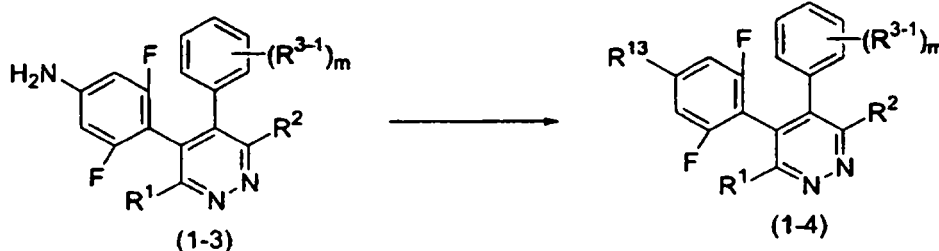
La cantidad del compuesto alcoholato utilizada en la reacción habitualmente es una proporción de 1 a 20 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (1-1).

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en el intervalo de entre 0°C y 120°C, y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en el intervalo de entre 1 y 72 horas.

Tras completar la reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se somete a una operación posterior al tratamiento, tal como la adición de agua a la mezcla de reacción y la extracción con un solvente orgánico, y la capa orgánica resultante se seca, se concentra y similares; de esta manera puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (1-2). El compuesto representado por la fórmula (1-2) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similares.

### Procedimiento de producción 3

El compuesto representado por la fórmula (1-4), de entre los compuestos de la presente invención, puede producirse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (1-3) con nitrito de alquilo y haluro de cobre (II).



(en las que, R<sup>2</sup> y m presentan los mismos significados que se han proporcionado anteriormente, R<sup>1</sup> es un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, R<sup>3-1</sup> es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, o un grupo alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, y R<sup>13</sup> es un átomo de cloro o un átomo de bromo).

La reacción habitualmente se lleva a cabo en un solvente.

Entre los ejemplos del solvente utilizado en la reacción se incluyen acetonitrilo, propionitrilo y similares. El nitrito de alquilo utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, nitrito de terc-butilo y nitrito de isoamilo y el haluro de cobre (II) incluye, por ejemplo, cloruro de cobre (II) y bromuro de cobre (II) y estos se seleccionan dependiendo del tipo de R<sup>13</sup> del compuesto representado por la fórmula (1-4).

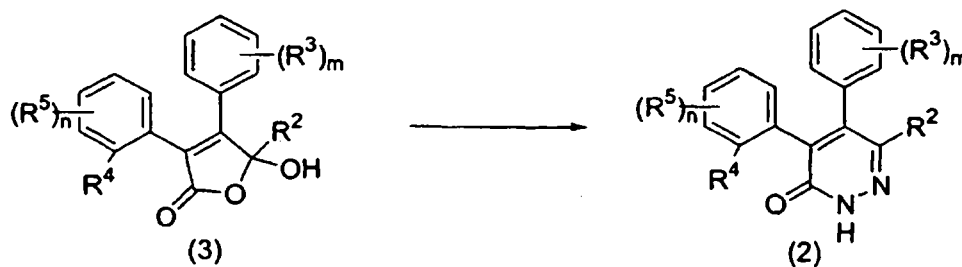
Las cantidades del nitrito de alquilo y del haluro de cobre (II) utilizadas en la reacción habitualmente se encuentran, cada una, en una proporción de 1 a 2 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (1-3).

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en un intervalo de 0°C a 50°C, y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en un intervalo de entre 1 y 24 horas.

Tras completar la reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se somete a una operación posterior al tratamiento, tal como la adición de agua a la mezcla de reacción y la extracción con un solvente orgánico, y la capa orgánica resultante se seca, se concentra y similares; de esta manera puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (1-4). El compuesto representado por la fórmula (1-4) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similares.

A continuación, se muestran ejemplos de producción de productos intermedios del compuesto de la presente invención como procedimientos de producción de referencia.

Procedimiento de producción 1 de referencia



15 (en las que  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $m$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y  $n$  presentan los mismos significados indicados anteriormente).

20 El compuesto representado por la fórmula (2) puede producirse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (3) con hidrazina.

25 La reacción se lleva a cabo habitualmente en un solvente.

El solvente utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol y similares, éteres tales como tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano y similares, y mezclas de los mismos.

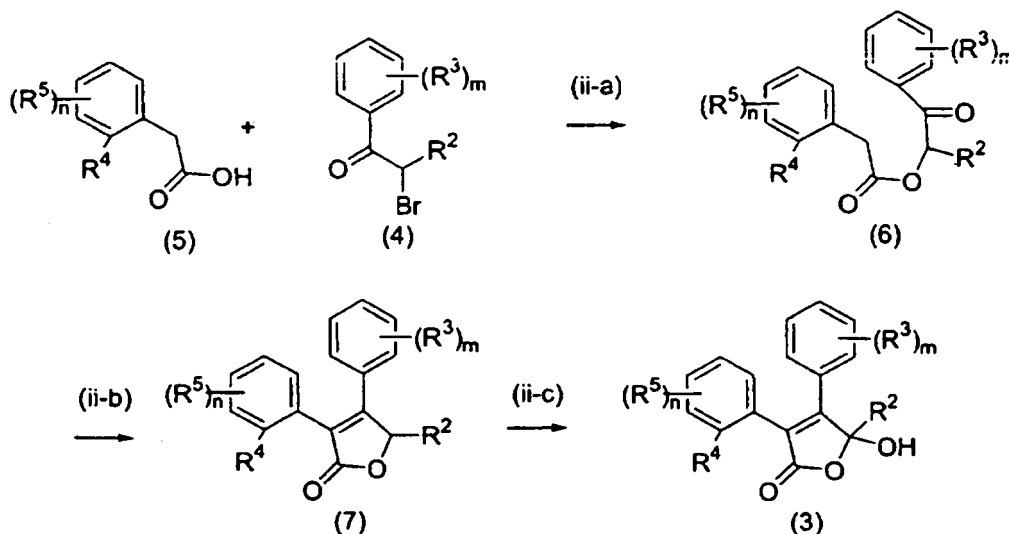
30 La cantidad de hidrazina utilizada en la reacción habitualmente es una proporción de 1 a 5 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (3). La hidrazina utilizada en la reacción puede ser el hidrato de la misma.

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en un intervalo de entre  $0^{\circ}\text{C}$  y  $120^{\circ}\text{C}$ , y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en un intervalo de entre 1 y 24 horas.

35 Tras completar la reacción, el compuesto representado por la fórmula (2) puede aislarse mediante una operación posterior al tratamiento, tal como el enfriamiento de la mezcla de reacción para depositar sólidos que seguidamente se separan mediante filtración, o concentrando la mezcla de reacción y similar. El compuesto representado por la fórmula (2) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similares.

Procedimiento de producción 2 de referencia

40 El compuesto representado por la fórmula (3) puede producirse según el esquema siguiente.



(en el que  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $m$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y  $n$  presentan los mismos significados indicados anteriormente).

65 El procedimiento de producción mostrado en el esquema anteriormente indicado está compuesto de un procedimiento (ii-a), un procedimiento (ii-b) y un procedimiento (ii-c).

## ES 2 324 883 T3

La reacción en el procedimiento (ii-a) puede llevarse a cabo, por ejemplo, mezclando el compuesto representado por la fórmula (4); el compuesto representado por la fórmula (5); una amina terciaria acíclica, tal como trietilamina, diisopropiletilamina y similares, y un solvente.

5 El solvente utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares.

Respecto a la cantidad del reactivo utilizado en la reacción, la proporción del compuesto representado por la fórmula (5) habitualmente se encuentra comprendida entre 0,8 y 1,3 moles y la proporción de base débil habitualmente se encuentra comprendida entre 0,8 y 1,3 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (4).

10

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en el intervalo de 0°C a 50°C, y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en un intervalo de 1 a 48 horas.

Tras completar la reacción, la mezcla de reacción misma puede utilizarse en la reacción del procedimiento (ii-b).

15

La reacción del procedimiento (ii-b) puede llevarse a cabo, por ejemplo, mezclando la mezcla de reacción obtenida mediante la reacción del procedimiento (ii-a) con por lo menos un compuesto de amina cíclica seleccionado de entre 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN) y 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (trietilendiamina).

20

La cantidad del compuesto de amina cíclica utilizada en la reacción habitualmente es una proporción de 1 a 3 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (6).

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida entre -20°C y 50°C, y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en un intervalo de entre 1 y 8 horas.

25

Tras completar la reacción, la mezcla de reacción puede utilizarse sin modificación en la reacción del procedimiento (ii-c).

La reacción del procedimiento (ii-c) puede llevarse a cabo, por ejemplo, introduciendo mediante soplado un gas que contiene oxígeno en la mezcla de reacción obtenida mediante la reacción del procedimiento (ii-b).

30

El gas que contiene oxígeno utilizado en dicha reacción incluye, por ejemplo, oxígeno y aire.

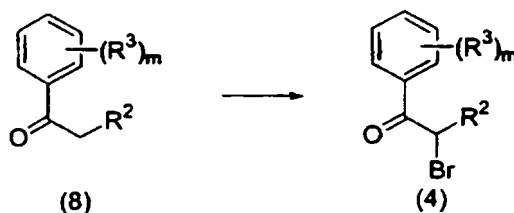
La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en un intervalo de entre 0°C y 50°C, y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en un intervalo de entre 1 y 24 horas.

35

Tras completar la reacción del procedimiento (ii-c), la mezcla de reacción se somete a una operación posterior al tratamiento, tal como la adición de ácido hidrocórico diluido a la mezcla de reacción y la extracción con un solvente orgánico, y el secado, concentración y similar de la capa orgánica resultante; de esta manera puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (3). El compuesto representado por la fórmula (3) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similares.

40

### 45 *Procedimiento de producción 3 de referencia*



(en las que R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y m presentan los mismos significados que se han proporcionado anteriormente).

El compuesto representado por la fórmula (4) puede producirse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (8) con bromo.

60

La reacción se lleva a cabo habitualmente en un solvente.

El solvente utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, ácido acético.

65

La cantidad de bromo utilizada en la reacción habitualmente es una proporción de 0,8 a 1,3 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (8).

## ES 2 324 883 T3

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en el intervalo de  $-10^{\circ}\text{C}$  a  $40^{\circ}\text{C}$ , y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

La reacción también puede llevarse a cabo en presencia de una cantidad catalítica de ácido hidrobromico.

5

Tras completar la reacción, la mezcla de reacción se somete a una operación posterior al tratamiento, tal como la concentración de la mezcla de reacción, o la adición de agua a la mezcla de reacción y la extracción con un solvente orgánico, el lavado de la capa orgánica con una solución acuosa de hidrogenocarbonato sódico y agua, y el secado, concentración y similar; de esta manera puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (4). El compuesto representado por la fórmula (4) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similar.

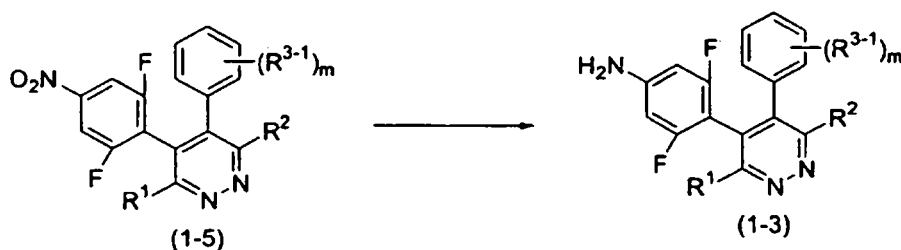
10

### Procedimiento de producción 4 de referencia

15

El compuesto representado por la fórmula (1-3) puede producirse sometiendo el compuesto representado por la fórmula (1-5) a una reacción de reducción.

20



30

(en las que  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{3-1}$  y  $m$  presentan los mismos significados que se han proporcionado anteriormente).

35

La reacción se lleva a cabo, por ejemplo, en un solvente mixto de agua, ácido acético y acetato de etilo en presencia de hierro.

La cantidad de hierro utilizada en la reacción habitualmente es una proporción de entre 4 y 10 moles por cada mol del compuesto representado por la fórmula (1-5).

40

La temperatura de reacción habitualmente se encuentra comprendida en el intervalo de  $20^{\circ}\text{C}$  a  $100^{\circ}\text{C}$ , y el tiempo de reacción habitualmente se encuentra comprendido en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Tras completar la reacción, la mezcla de reacción se somete a una operación posterior al tratamiento, tal como la adición de agua a la mezcla de reacción y la extracción con un solvente orgánico, y la capa orgánica se seca, se concentra y similares; de esta manera puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (1-3). El compuesto representado por la fórmula (1-3) aislado también puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización y similar.

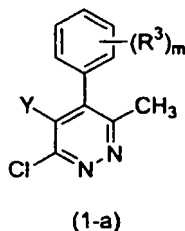
45

50

A continuación se proporcionan ejemplos específicos del compuesto de la presente invención.

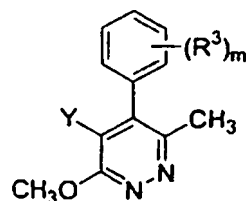
Compuesto de piridazina representado por la fórmula (1-a).

55



65

Compuesto de piridazina representado por la fórmula (1-b).



(1-b)

En la fórmula (1-a) o (1-b), (R<sup>3</sup>)<sub>m</sub> e Y representan una combinación de sustituyentes representada en la Tabla 1.

TABLA 1

(R <sup>3</sup> ) <sub>m</sub>	Y
4-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
3-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
2-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-CF <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
3-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
2-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
4-F	2,4,6-trifluorofenilo
4-NO <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-CN	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCF <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCHF <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCCIF <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCBrF <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-SCH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-SCF <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
-	2,4,6-trifluorofenilo
4-CH <sub>3</sub>	2-clorofenilo
4-Cl	2-clorofenilo
4-CH <sub>3</sub>	2-fluorofenilo
4-Cl	2-fluorofenilo
2-Cl, 4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
3-Cl, 4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
2-F, 4-F	2,4,6-trifluorofenilo
2-F, 4-Cl	2,9,6-trifluorofenilo
4-CH <sub>3</sub>	2-nitrofenilo
4-Cl	2-nitrofenilo

## ES 2 324 883 T3

TABLA 1 (continuación)

	(R <sup>3</sup> )m	Y
5	4-CH <sub>3</sub>	2-cianofenilo
	4-Cl	2-cianofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
10	4-CF <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-F	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
15	2-Cl, 4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	3-Cl, 4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
20	2-F, 4-F	2-cloro-6-fluorofenilo
	2-F, 4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-CF <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
25	4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-F	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	2-Cl, 4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
30	3-Cl, 4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	2-F, 4-F	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
35	2-F, 4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-etoxifenilo
	4-Cl	2,6-difluoro-4-etoxifenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-metilfenilo
40	4-Cl	2-metilfenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-(trifluorometil)fenilo
	4-Cl	2-(trifluorometil)fenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
45	3-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	2-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-CF <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-Cl	2,6-difluorofenilo
50	3-Cl	2,6-difluorofenilo
	2-Cl	2,6-difluorofenilo
	4-F	2,6-difluorofenilo
	4-NO <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
55	4-CN	2,6-difluorofenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-OCF <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-OCHF <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-OCCIF <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
60	4-OCBrF <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-SCH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-SCF <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo

65

ES 2 324 883 T3

TABLA 1 (continuación)

	(R <sup>3</sup> )m	Y
5	-	2,6-difluorofenilo
	2-Cl, 4-Cl	2,6-difluorofenilo
	3-Cl, 4-Cl	2,6-difluorofenilo
10	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	2-F, 4-F	2,6-difluorofenilo
15	2-F, 4-Cl	2,6-difluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	4-CF <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	4-Cl	2,4-difluorofenilo
20	4-F	2,4-difluorofenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	2-Cl, 4-Cl	2,4-difluorofenilo
	3-Cl, 4-Cl	2,4-difluorofenilo
25	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,9-difluorofenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,9-difluorofenilo
	2-F, 4-F	2,4-difluorofenilo
	2-F, 4-Cl	2,4-difluorofenilo
30	4-CH <sub>3</sub>	2,3,4-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,4-trifluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,3,5-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,5-trifluorofenilo
35	4-CH <sub>3</sub>	2,3,6-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,6-trifluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,4,5-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,5-trifluorofenilo
40	4-CH <sub>3</sub>	2,3-difluorofenilo
	4-Cl	2,3-difluorofenil
	4-CH <sub>3</sub>	2,5-difluorofenilo
	4-Cl	2,5-difluorofenilo
45	4-CH <sub>3</sub>	2-(difluorometoxi)fenilo
	4-Cl	2-(difluorometoxi)fenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-(difluorometoxi)fenilo
	4-Cl	2-(difluorometoxi)fenilo
50	4-CH <sub>3</sub>	2-metoxifenilo
	4-Cl	2-metoxifenilo
	4-Cl	pentafluorofenilo
	4-Cl	4-metoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	4-etoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
55	4-Cl	4-ciano-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	4-nitro-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	2,6-difluoro-4-cianofenilo
60	4-Cl	2,6-difluoro-4-nitrofenilo
	4-Cl	2,6-difluoro-4-clorofenilo

65

ES 2 324 883 T3

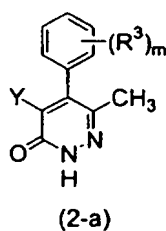
TABLA 1 (continuación)

(R <sup>3</sup> ) <sub>m</sub>	Y
4-Cl	2,6-difluoro-4-(trifluorometil)fenilo
4-Cl	2-fluoro-6-metilfenilo
4-Cl	2-fluoro-6-nitrofenilo
4-Cl	2-ciano-6-florofenilo
4-Cl	2-fluoro-6-(trifluorometil)fenilo
4-Cl	2-(difluorometoxi)-6-fluorofenilo
4-Cl	2-fluoro-6-(trifluorometoxi)fenilo
4-Cl	2-fluoro-6-metoxifenilo
4-Cl	2,3-difluoro-6-(trifluorometil)fenilo
4-Cl	2,6-difluoro-3-clorofenilo

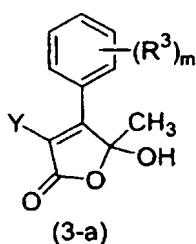
En la tabla, “-” significa que m es 0.

A continuación, se proporcionan ejemplos específicos del producto intermedio del compuesto de la presente invención.

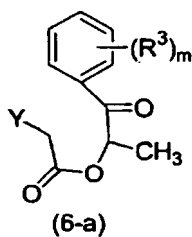
El compuesto representado por la fórmula (2-a):



El compuesto representado por la fórmula (3-a):

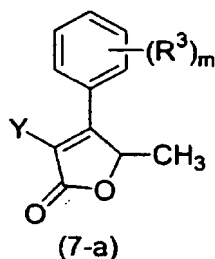


El compuesto representado por la fórmula (6-a):



ES 2 324 883 T3

El compuesto representado por la fórmula (7-a):



En las fórmulas (2-a), (3-a), (6-a) o (7-a),  $(R^3)_m$  e Y representan una combinación de sustituyentes representada en la Tabla 2.

TABLA 2

$(R^3)_m$	Y
4-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
3-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
2-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-CF <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
3-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
2-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
4-F	2,4,6-trifluorofenilo
4-NO <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-CN	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCF <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCHF <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCCIF <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-OCBrF <sub>2</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-SCH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
4-SCF <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
-	2,4,6-trifluorofenilo
4-CH <sub>3</sub>	2-clorofenilo
4-Cl	2-clorofenilo
4-CH <sub>3</sub>	2-fluorofenilo
4-Cl	2-fluorofenilo
2-Cl, 4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
3-Cl, 4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	2,4,6-trifluorofenilo
2-F, 4-F	2,4,6-trifluorofenilo
2-F, 4-Cl	2,4,6-trifluorofenilo
4-CH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo

## ES 2 324 883 T3

TABLA 2 (continuación)

	(R <sup>3</sup> ) <sub>m</sub>	Y
5	4-CF <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-F	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
10	2-Cl, 4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	3-Cl, 4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
15	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2-cloro-6-fluorofenilo
	2-F, 4-F	2-cloro-6-fluorofenilo
	2-F, 4-Cl	2-cloro-6-fluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-metilfenilo
	4-Cl	2-metilfenilo
20	4-CH <sub>3</sub>	2-(trifluorometil)fenilo
	4-Cl	2-(trifluorometil)fenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-CF <sub>3</sub>	2,6-difluoro-9-metoxifenilo
25	4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-F	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-9-metoxifenilo
	2-Cl, 4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
30	3-Cl, 4-Cl	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-9-metoxifenilo
	2-F, 4-F	2,6-difluoro-9-metoxifenilo
35	2-F, 4-Cl	2,6-difluoro-9-metoxifenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluoro-9-etoxifenilo
	4-Cl	2,6-difluoro-4-etoxifenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-nitrofenilo
40	4-Cl	2-nitrofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-cianofenilo
	4-Cl	2-cianofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
45	3-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	2-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-CF <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-Cl	2,6-difluorofenilo
50	3-Cl	2,6-difluorofenilo
	2-Cl	2,6-difluorofenilo
	4-F	2,6-difluorofenilo
	4-NO <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
55	4-CN	2,6-difluorofenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-OCF <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-OCHF <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
60	4-OCCIF <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-OCBrF <sub>2</sub>	2,6-difluorofenilo
	4-SCH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo

65

ES 2 324 883 T3

TABLA 2 (continuación)

	(R <sup>3</sup> ) <sub>m</sub>	Y
5	4-SCF <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	-	2,6-difluorofenilo
	2-Cl, 4-Cl	2,6-difluorofenilo
	3-Cl, 4-Cl	2,6-difluorofenilo
10	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	2,6-difluorofenilo
	2-F, 4-F	2,6-difluorofenilo
15	2-F, 4-Cl	2,6-difluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	4-CF <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	4-Cl	2,4-difluorofenilo
20	4-F	2,4-difluorofenilo
	4-OCH <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	2-Cl, 4-Cl	2,4-difluorofenilo
	3-Cl, 4-Cl	2,4-difluorofenilo
25	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	2,4-difluorofenilo
	2-F, 4-F	2,4-difluorofenilo
	2-F, 4-Cl	2,4-difluorofenilo
30	4-CH <sub>3</sub>	2,3,4-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,4-trifluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,3,5-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,5-trifluorofenilo
35	4-CH <sub>3</sub>	2,3,6-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,6-trifluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,3,5-trifluorofenilo
	4-Cl	2,3,5-trifluorofenilo
40	4-CH <sub>3</sub>	2,3-difluorofenilo
	4-Cl	2,3-difluorofenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2,5-difluorofenilo
	4-Cl	2,5-difluorofenilo
45	4-CH <sub>3</sub>	2-(difluorometoxi)fenilo
	4-Cl	2-(difluorometoxi)fenilo
	4-CH <sub>3</sub>	2-(difluorometoxi)fenilo
	4-Cl	2-(difluorometoxi)fenilo
50	4-CH <sub>3</sub>	2-(trifluorometoxi)fenilo
	4-Cl	2-(trifluorometoxi)fenio
	4-CH <sub>3</sub>	2-metoxifenilo
	4-Cl	2-metoxifenilo
55	4-Cl	pentafluorofenilo
	4-Cl	4-metoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	4-etoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	4-ciano-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
60	4-Cl	4-nitro-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	2,3,5,6-tetrafluorofenilo
	4-Cl	2,6-difluoro-4-cianofenilo

65

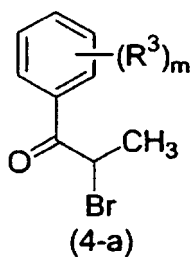
ES 2 324 883 T3

TABLA 2 (continuación)

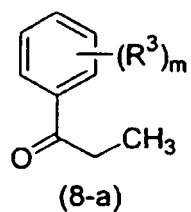
$(R^3)_m$	Y
4-Cl	2,6-difluoro-4-nitrofenilo
4-Cl	2,6-difluoro-4-clorofenilo
4-Cl	2,6-difluoro-4-(trifluorometil)fenilo
4-Cl	2-fluoro-6-metilfenilo
4-Cl	2-fluoro-6-nitrofenilo
4-Cl	2-ciano-6-fluorofenilo
4-Cl	2-fluoro-6-(trifluorometil)fenilo
4-Cl	2-(difluorometoxi)-6-fluorofenilo
4-Cl	2-fluoro-6-(trifluorometoxi)fenilo
4-Cl	2-fluoro-6-metoxifenilo
4-Cl	2,3-difluoro-6-(trifluorometil)fenilo
4-Cl	2,6-difluoro-3-clorofenilo

En la tabla, “-” significa que m es 0.

El compuesto representado por la fórmula (4-a):



El compuesto representado por la fórmula (8-a):



## ES 2 324 883 T3

En la fórmula (4-a) o (8-a),  $(R^3)_m$  representa uno de los sustituyentes representados en la Tabla 3.

5

TABLA 3

10

15

20

25

30

35

40

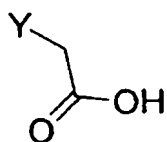
$(R^3)_m$
4-CH <sub>3</sub>
3-CH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>
4-CF <sub>3</sub>
4-Cl
3-Cl
2-Cl
4-F
4-NO <sub>2</sub>
4-CN
4-OCH <sub>3</sub>
4-OCF <sub>3</sub>
4-OCHF <sub>2</sub>
4-OCCIF <sub>2</sub>
4-OCBrF <sub>2</sub>
4-SCH <sub>3</sub>
4-SCF <sub>3</sub>
-
2-Cl, 4-Cl
3-Cl, 4-Cl
2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>
3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>
3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>
2-F, 4-F
2-F, 4-Cl

En la tabla, “-” significa que m es 0.

45

El compuesto representado por la fórmula (5-a):

50



55

(5-a)

60

65

## ES 2 324 883 T3

En la fórmula (5-a), Y representa uno de los sustituyentes representados en la Tabla 4.

TABLA 4

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

Y
2,4,6-trifluorofenilo
2-cloro-6-fluorofenilo
2,6-difluoro-4-metoxifenilo
2,6-difluoro-4-etoxifenilo
2,6-difluorofenilo
2,4-difluorofenilo
2,3,4-trifluorofenilo
2,3,5-trifluorofenilo
2,3,6-trifluorofenilo
2,4,5-trifluorofenilo
2,3-difluorofenilo
2,5-difluorofenilo
2-clorofenilo
2-fluorofenilo
2-nitrofenilo
2-cianofenilo
2-metilfenilo
2-(trifluorometil)fenilo
2-(difluorometoxi)fenilo
2-(trifluorometoxi)fenilo
2-metoxifenilo
pentafluorofenilo
4-metoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
4-etoxi-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
4-ciano-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
4-nitro-2,3,5,6-tetrafluorofenilo
2,3,5,6-tetrafluorofenilo
2,6-difluoro-4-cianofenilo
2,6-difluoro-4-nitrofenilo
2,6-difluoro-4-clorofenilo
2,6-difluoro-4-(trifluorometil)fenilo
2-fluoro-6-metilfenilo
2-fluoro-6-nitrofenilo
2-ciano-6-fluorofenilo
2-fluoro-6-(trifluorometil)fenilo
2-(difluorometoxi)-6-fluorofenilo
2-fluoro-6-(trifluorometoxi)fenilo
2-fluoro-6-metoxifenilo
2,3-difluoro-6-(trifluorometil)fenilo
2,6-difluoro-3-clorofenilo

A continuación se ejemplifican las enfermedades de las plantas controladas por el presente compuesto.

Del arroz: *Pyricularia oryzae*, *Cochliobolus miyabeanus* y *Rhizoctonia solani*;

65

de los cítricos: *Erysiphe graminis*, *Gibberella zea*, *Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*, *Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*, *Ustilago tritici*, *U. nuda*, *Tilletia caries*, *Pseudocercospora herpotrichoides*,

## ES 2 324 883 T3

*Rhynchosporium secalis*, *Septoria tritici* y *Leptosphaeria nodorum*, de trigo y cebada; *Diaporthe citri*, *Elsinoe fawcetti*, *Penicillium digitatum* y *P. italicum*;

del manzano: *Sclerotinia mali*, *Valsa mali*, *Podosphaera leucotricha*, *Alternaria mali* y *Venturia inaequalis*;

del peral: *Venturia nashicola*, *V. pirina*, *Alternaria kikuchiana* y *Gymnosporangium haraeaeum*; del melocotón: *Sclerotinia cinerea*, *Cladosporium carpophilum* y *Phomopsis* sp.; de la vid: *Elsinoe ampelina*, *Glomerella cingulata*, *Uncinula necator*, *Phakopsora ampelopsidis*, *Guignardia bidwellii* y *Plasmopara viticola*;

del persimon japonés: *Gloeosporium kaki*, *Cercospora kaki* y *Mycosphaerella nawae*;

de las cucurbitáceas: *Colletotrichum lagenarium*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Mycosphaerella melonis*, *Fusarium oxysporum*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Phytophthora* sp. y *Pythium* sp.;

de la tomatera: *Alternaria solani*, *Cladosporium fulvum* y *Phytophthora infestans*;

de la planta de la berenjena: *Phomopsis vexans* y *Erysiphe cichoracearum*;

de las verduras crucíferas: *Alternaria japonica* y *Cercospora brassicae*;

de la cebolla verde: *Puccinia allii*; de la soja: *Cercospora kikuchii*, *Elsinoe glycines* y *Diaporthe phaseolorum* var. *sojiae*;

de la planta de la alubia: *Colletotrichum lindemthianum*;

del cacahuete: *Cercospora personata* y *Cercospora arachidicola*; del guisante: *Erysiphe pisi*;

de la patata: *Alternaria solani* y *Phytophthora infestans*;

del fresal: *Sphaerotecha humuli*; del té: *Exobasidium reticulatum* y *Elsinoe leucospila*;

de la planta del tabaco: *Alternaria longipes*, *Erysiphe cichoracearum*, *Colletotrichum tabacum*, *Peronospora tabacina* y *Phytophthora nicotianae*;

de la remolacha azucarera: *Cercospora beticola*;

del rosal: *Diplocarpon rosae* y *Sphaerotheca pannosa*;

del crisantemo: *Septoria chrysanthemi-indici* y *Puccinia horiana*;

de diversos cultivos: *Botrytis cinerea* y *Sclerotinia sclerotiorum*; del rábano: *Alternaria brassicicola*;

y del césped: *Sclerotinia homeocarpa* y *Rhizoctonia solani*.

Puede demostrarse el efecto fungicida mediante el tratamiento de plantas o suelos con el compuesto de la presente invención sin modificación. Sin embargo, habitualmente se utiliza en forma de composición que comprende el compuesto de la presente invención y un portador. Es decir, se formula la composición fungicida de la presente invención en forma de concentrado emulsionable, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, concentrado en suspensión, polvos, gránulos y similares mediante la mezcla del compuesto de la presente invención y un portador sólido y/o un portador líquido y, en caso necesario, añadiendo otro adyuvante para la formulación, tal como surfactante.

Dichas formulaciones habitualmente contienen entre 0,1% y 90% en peso del compuesto de la presente invención.

Entre los portadores sólidos utilizados para la formulación se incluyen, por ejemplo, polvos finos o gránulos de minerales, tales como arcilla de caolín, arcilla atapulgita, bentonita, montmorillonita, terra alba, pirofilita, talco, tierra diatomácea, calcita y similares; sustancias orgánicas naturales, tales como polvos de mazorca de maíz, polvos de cáscaras de nueces y similares; sustancias orgánicas sintéticas, tales como urea y similares; sales, tales como carbonato cálcico, sulfato amónico y similares; sustancias inorgánicas sintéticas, tales como óxido de silicio hidratado sintético y similares. Entre los portadores líquidos se incluyen, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, alquilbenceno, metilnaftaleno y similares; alcoholes, tales como 2-propanol, etilenglicol, propilenglicol, celosolve y similares; cetonas, tales como acetona, ciclohexanona, isoforona y similares; aceites vegetales, tales como aceite de soja, aceite de semilla de algodón y similares; hidrocarburos alifáticos, ésteres, dimetilsulfóxido, acetonitrilo y agua.

Entre los surfactantes se incluyen, por ejemplo, surfactantes aniónicos, tales como sal de éster de ácido alquilsulfúrico, sal de ácido alquilarilsulfónico, sal de ácido dialquilsulfosuccínico, sal de éster de ácido polioxietilenaalquilarileterfosfórico, sal de ácido sulfónico de lignina, naftalensulfonato policondensado con formaldehído y similares, y

## ES 2 324 883 T3

surfactantes no iónicos, tales como éter polioxietilentalquilario, copolímero en bloque polioxietilentalquilpolioxipropileno, éster de ácido graso de sorbitán y similares.

Otro adyuvante para la formulación incluye, por ejemplo, polímeros solubles en agua, tales como alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona y similares, goma arábiga, ácido algínico y sal del mismo; polisacáridos, tales como CMC (carboximetilcelulosa), goma xantano y similares; sustancias inorgánicas, tales como silicato de aluminio-magnesio, sal de alúmina y similares, y conservantes, colorantes, PAP (fosfato de ácido isopropílico), agentes estabilizadores, tales como BHT y similares.

Mediante la aplicación de la composición fungicida de la presente invención en el follaje de las plantas, éstas pueden protegerse frente a enfermedades de las plantas, y mediante la aplicación de la composición fungicida de la presente invención en suelos, las plantas cultivadas en dichos suelos pueden protegerse frente a enfermedades de las plantas. Es decir, la composición fungicida de la presente invención habitualmente se utiliza para un procedimiento para controlar enfermedades de las plantas, que comprende una etapa de aplicación de una cantidad efectiva de la composición fungicida de la presente invención en plantas o suelos para el cultivo de plantas.

En el caso de que se aplique en plantas la composición fungicida de la presente invención o en el caso de que la composición fungicida de la presente invención se aplique en un suelo, la cantidad aplicada de la misma, que puede modificarse con un tipo de plantas de control, un tipo de enfermedades de control, un nivel de infestación de enfermedades de control, tipos de formulación, tiempos de aplicación, condiciones meteorológicas y similares, habitualmente se encuentra comprendida entre 1 y 5.000 g, preferentemente entre 5 y 1.000 g, del compuesto de la presente invención por cada 10.000 m<sup>2</sup>.

El concentrado emulsionable, los polvos humectables, los concentrados en suspensión y similares habitualmente se pulverizan tras la dilución con agua. En este caso, la concentración del compuesto de la presente invención habitualmente se encuentra comprendida en el intervalo de 0,0001% a 3% en peso, preferentemente entre 0,0005% y 1% en peso. Los polvos, gránulos y similares habitualmente se aplican directamente sin dilución.

La composición fungicida de la presente invención también puede aplicarse en procedimientos de tratamiento de desinfección de semillas. Entre los procedimientos se incluye, por ejemplo, un procedimiento para empapar semillas de una planta en una composición fungicida de la presente invención preparada a una concentración de entre 1 y 1.000 ppm en términos de concentración del compuesto de la presente invención, un procedimiento para pulverizar o recubrir semillas de una planta con la composición fungicida de la presente invención preparada a una concentración de entre 1 y 1.000 ppm, en términos de concentración del compuesto de la presente invención, y un procedimiento para recubrir semillas de una planta con una composición fungicida de la presente invención que se formula en forma de polvos.

El procedimiento para controlar las enfermedades de las plantas de la presente invención habitualmente se lleva a cabo mediante la aplicación de una cantidad efectiva de la composición fungicida de la presente invención en una planta o en un suelo para el cultivo de la planta en la que puede preverse la infección.

La composición fungicida de la presente invención habitualmente se utiliza como fungicida para controlar enfermedades de las plantas en la agricultura o en jardinería, es decir, como agente para controlar enfermedades de las plantas en campos arados, arrozales, huertos, campos de té, pastos, céspedes y similares.

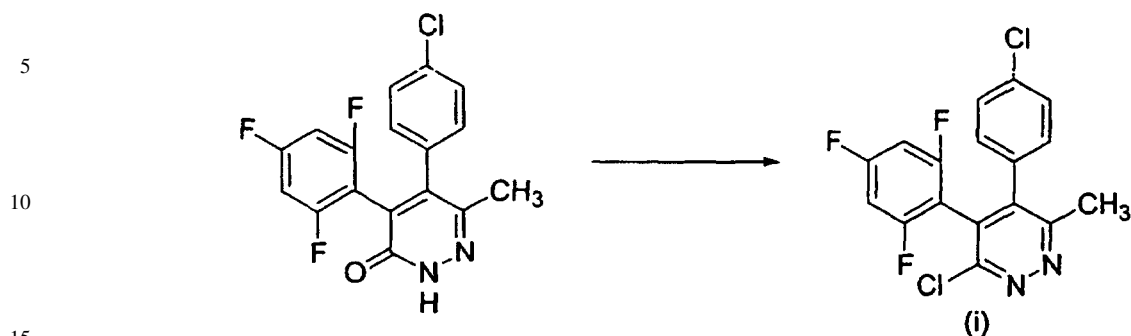
La composición fungicida de la presente invención puede utilizarse conjuntamente con otros fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal y/o fertilizantes.

Entre los ejemplos del ingrediente activo de los fungicidas se incluyen compuestos fungicidas azol, tales como propiconazol, triadimenol, procloraz, penconazol, tebuconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, epoxiconazol, difenoconazol, ciproconazol, metconazol, trifulmizol, tetraconazol, miclobutanil, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol, imazalil, flutriafol, etc.; compuestos fungicidas de amina cíclica, tales como fenpropimorf, tridemorf, fenpropidín, etc.; compuestos fungicidas benzimidazol, tales como carbendazim, benomil, tiabendazol, tiofanato-metilo, etc.; procimidona; ciprodinil; pirimetanil; dietofencarb; tiuram; fluazinil; mancozeb; iprodiona; vinclozólín; clorotalonil; captan; mepanipirim; fenpiclonil; fludioxonil; diclorfluanid; folpet; cresoxim-metilo; azoxistrobín; trifloxistrobín; picoxistrobín; piraclostrobin; N-metil- $\alpha$ -metoxiimino-2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenilacetamida; espiroxamina; quinixifén; fenhexamida; famoxadona; fenamidona; iprovalicarb; bentiavalicarb; ciazofamid; boscalid; metrafenona y ciflufenamid.

A continuación, la presente invención se ilustra además con mayor detalle mediante ejemplos de producción, ejemplos de formulación, ejemplos de ensayo y similares, aunque la presente invención no se encuentra limitada a dichos ejemplos.

En primer lugar, se describen ejemplos de producción del compuesto de la presente invención.

## Ejemplo de producción 1

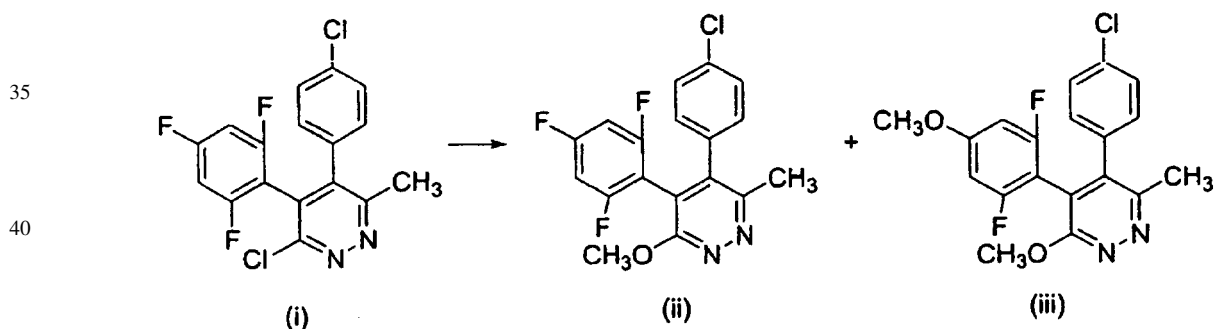


20 Se mezclaron 4,00 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 20 ml de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 4,16 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominado compuesto (i) de la presente invención).

25 Compuesto (i) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54 (3H, s), 6,63 (2H, dd, J = 7,3, 8,5 Hz), 7,01 (2H, d, J = 8,7 Hz), 7,32 (2H, d, J = 8,7 Hz).

## 30 Ejemplo de producción 2



50 Se mezclaron 1,01 g de compuesto (i) de la presente invención, 0,58 g de metóxido sódico (solución en metanol al 28%) y 6 ml de metanol, y se agitaron a temperatura ambiente durante 1 día, y después a 60°C durante la noche. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente. Se vertió agua en la mezcla de reacción y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato sódico anhidro, después se concentró bajo presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía de columna de gel de sílice (solvente de elución: hexano-acetato de etilo), obteniendo 0,32 g de 5-(4-clorofenil)-3-metoxi-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (ii) de la presente invención) y 89 mg de 5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-3-metoxi-6-piridazina (en adelante denominada compuesto (iii) de la presente invención), respectivamente.

55 Compuesto (ii) de la presente invención:

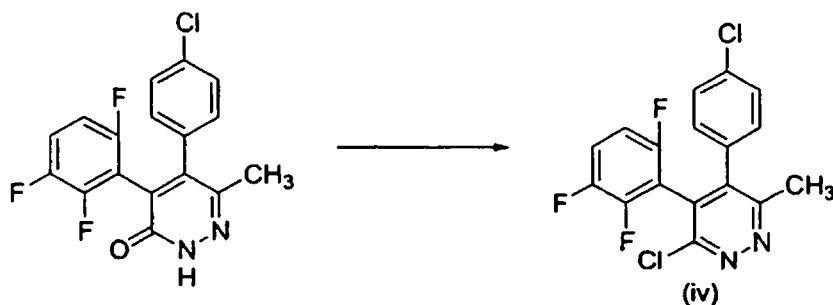
60 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,44 (3H, s), 4,11 (3H, s), 6,57 (2H, dd, J = 7,3, 8,7 Hz), 7,00 (2H, d, J = 8,5 Hz), 7,29 (2H, d, J = 8,5 Hz).

El compuesto (iii) de la presente invención:

65 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,43 (3H, s), 3,75 (3H, s), 4,10 (3H, s), 6,34 (2H, d, J = 9,0 Hz), 7,02 (2H, d, J = 8,5 Hz), 7,28 (2H, d, J = 8,5 Hz).

## ES 2 324 883 T3

### Ejemplo de producción 3

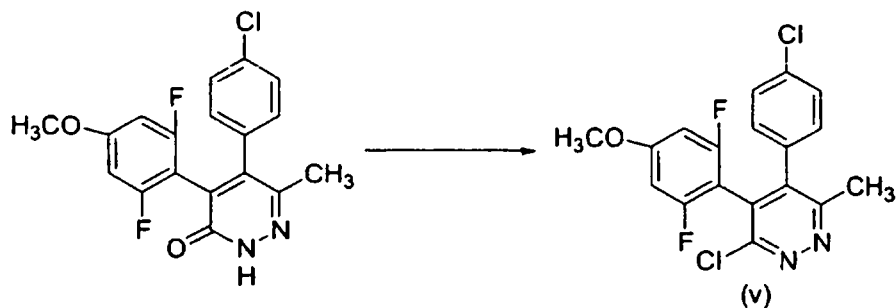


20 Se mezclaron 3,50 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,3,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 15 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 3,68 g de 3-cloro-5-(9-clorofenil)-6-metil-4-(2,3,6-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (iv) de la presente invención).

25 Compuesto (iv) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,55 (3H, s), 6,75-6,85 (1H, m), 7,03 (2H, d, J = 8,4 Hz), 7,1-7,2 (1H, m), 7,32 (2H, d, J = 8,4 Hz).

### 30 Ejemplo de producción 4



50 Se mezclaron 185 mg de 5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-6-metil-1-2H-piridazín-3-ona y 5 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en capa fina preparativa (fase estacionaria: gel de sílice, solvente de revelado: hexano/acetato de etilo=3/1), obteniendo 161 mg de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominado compuesto (v) de la presente invención).

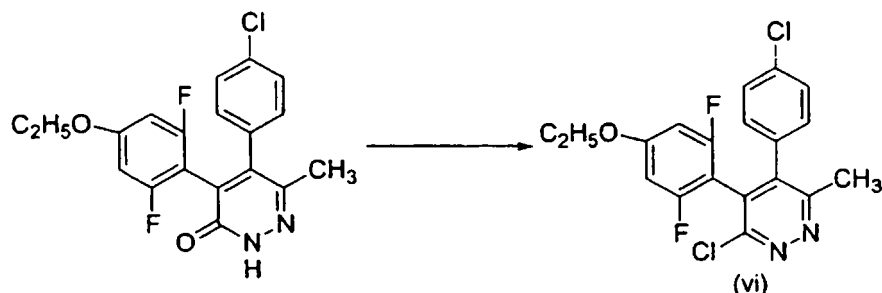
55 Compuesto (v) de la presente invención:

60 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,52(3H, s), 3,77(3H, s), 6,38(2H, dd, J = 4,12 Hz), 7,03(2H, d, J = 8 Hz), 7,31 (2H, d, J = 8 Hz).

65

## ES 2 324 883 T3

### Ejemplo de producción 5



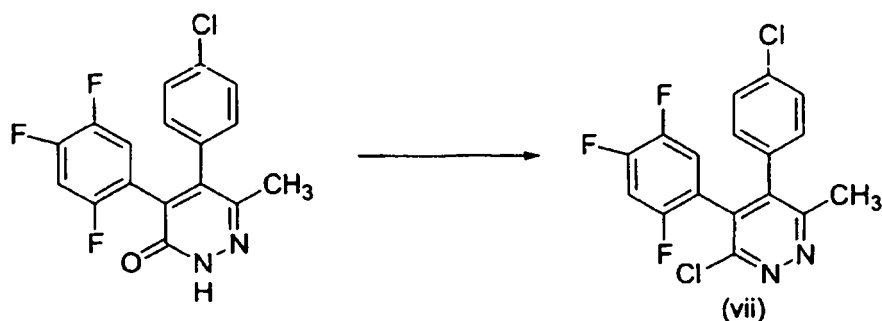
20 Se mezclaron 0,25 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-etoxifenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 5 g de oxicluro de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía preparativa de capa fina (fase estacionaria: gel de sílice, solvente de revelado: hexano/acetato de etilo=3/1), obteniendo 0,16 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-etoxifenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (vi) de la presente invención).

25

Compuesto (vi) de la presente invención:

30 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,40(3H, t, J = 7,2 Hz), 2,52(3H, s), 3,96(2H, q, J = 7,2 Hz), 6,36(2H, dd, J = 5,2, 14,4 Hz), 7,02(2H, d, J = 8,8 Hz), 7,30(2H, d, J = 8,8 Hz).

### Ejemplo de producción 6



50 Se mezclaron 2,09 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,5-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxicluro de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución salina hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 2,10 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,5-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (vii) de la presente invención).

55

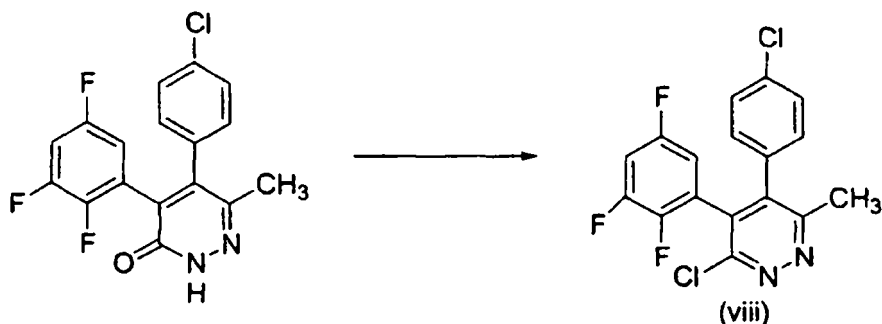
Compuesto (vii) de la presente invención:

60 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,53(3H, s), 6,8-6,95(2H), 6,95-7,05(2H, br), 7,33(2H, d, J = 8,8 Hz).

65

## ES 2 324 883 T3

### Ejemplo de producción 7

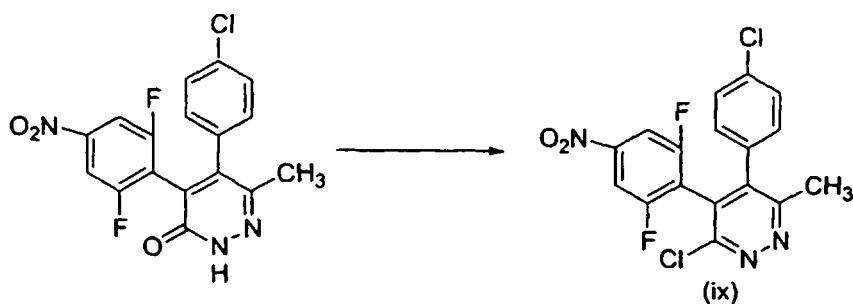


20 Se mezclaron 1,80 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,3,5-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 1,83 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,3,5-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (viii) de la presente invención).

25 Compuesto (viii) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,5-6,55(1H, m), 6,85-6,95(1H, m), 6,95-7,05 (2H, br), 7,34(2H, d, J = 8,4 Hz).

### Ejemplo de producción 8

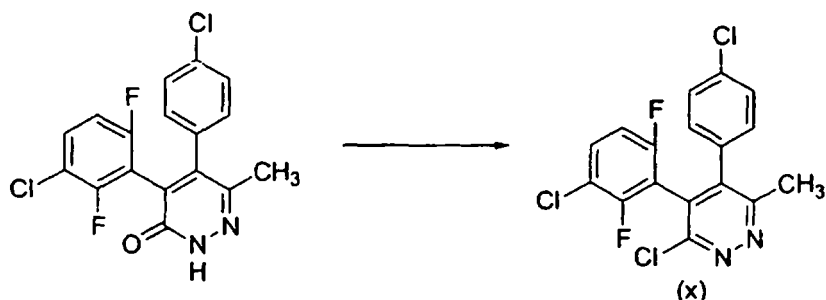


50 Se mezclaron 6,0 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-nitrofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 30 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 6,15 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-nitrofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (ix) de la presente invención).

55 Compuesto (ix) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,57(3H, s), 7,03(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,33(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,75-7,8(2H, m).

## Ejemplo de producción 9

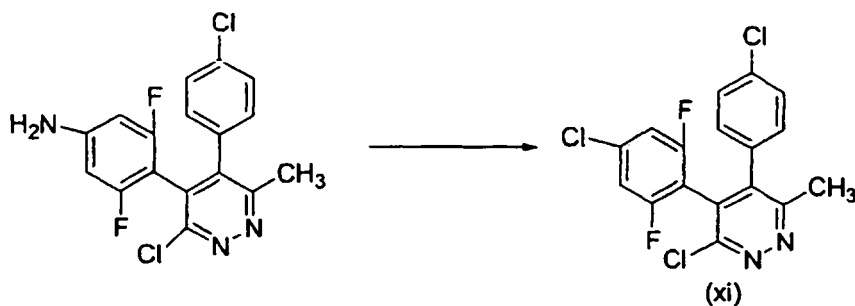


20 Se mezclaron 1,33 g de 4-(3-cloro-2,6-difluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclorigo de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 1,33 g de 3-cloro-4-(3-cloro-2,6-difluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (x) de la presente invención).

25 Compuesto (x) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,56(3H, s), 6,8-6,85(1H, m), 7,02(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,32(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,35-7,4(1H, m).

30 Ejemplo de producción 10



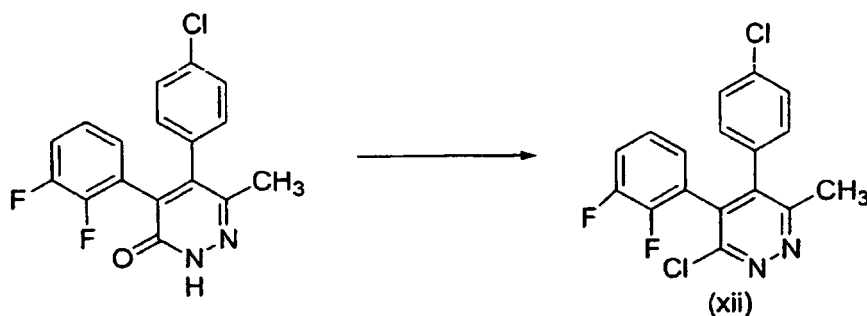
50 A una mezcla de 323 mg de cloruro de cobre (II) (CuCl<sub>2</sub>), 309 mg de nitrito de terc-butilo y 13 ml de acetonitrilo se le añadieron 732 mg de 4-(4-amino-2,6-difluorofenil)-3-cloro-5-(4-clorofenil)-6-metilpiridazina en partes bajo enfriamiento con hielo. Después, la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. A continuación, la mezcla de reacción se vertió en una mezcla de hielo y ácido hidroclicórico diluido, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó secuencialmente con bicarbonato sódico, agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía de columna de gel de sílice (solvente de elución: hexano:acetato de etilo=7:1), obteniendo 0,62 g de 3-cloro-4-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (xi) de la presente invención).

55 Compuesto (xi) de la presente invención:

60 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,90(2H, dd, J = 4,8, 11,6 Hz), 7,02(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,33(2H, d, J = 8,4 Hz).

65

## Ejemplo de producción 11

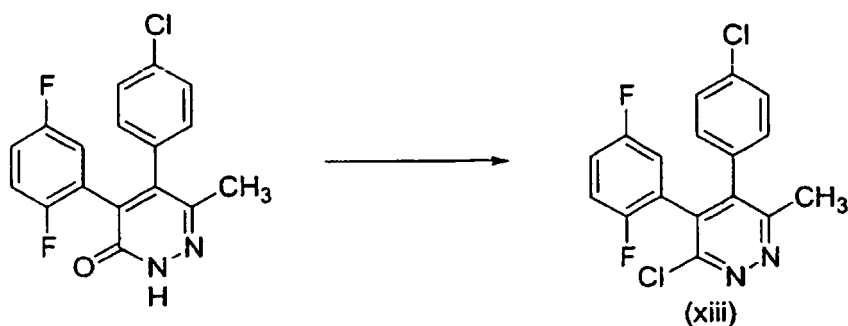


20 Se mezclaron 3,49 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,3-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 3,66 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,3-difluorofenil)-6-metil-piridazina (en adelante denominada compuesto (xii) de la presente invención).

25 Compuesto (xii) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,7-6,8(1H, m), 6,95-7,1(3H), 7,1-7,2(1H, m), 7,29(2H, d, J = 8,4 Hz).

## Ejemplo de producción 12



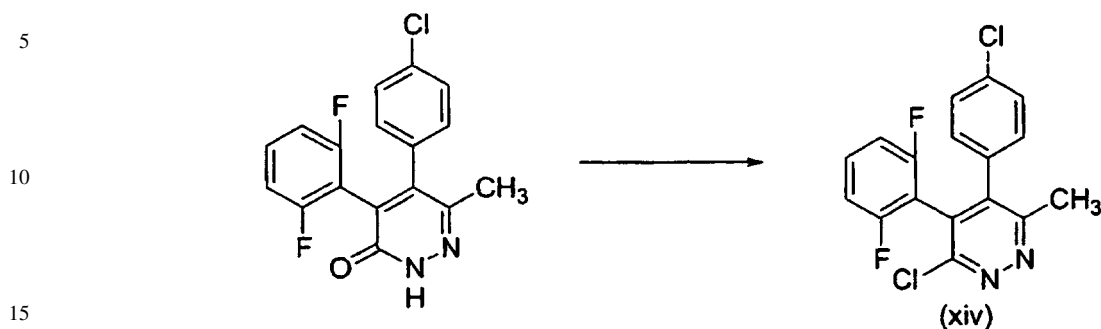
50 Se mezclaron 2,86 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,5-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 6,5 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía de columna de gel de sílice (solvente de elución: hexano:acetato de etilo=3,1, obteniendo 2,89 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,5-difluorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (xiii) de la presente invención).

55 Compuesto (xiii) de la presente invención:

60 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,7-6,75(1H, m), 6,95-7,05(4H), 7,33(2H, d, J = 8,8 Hz).

65

## Ejemplo de producción 13

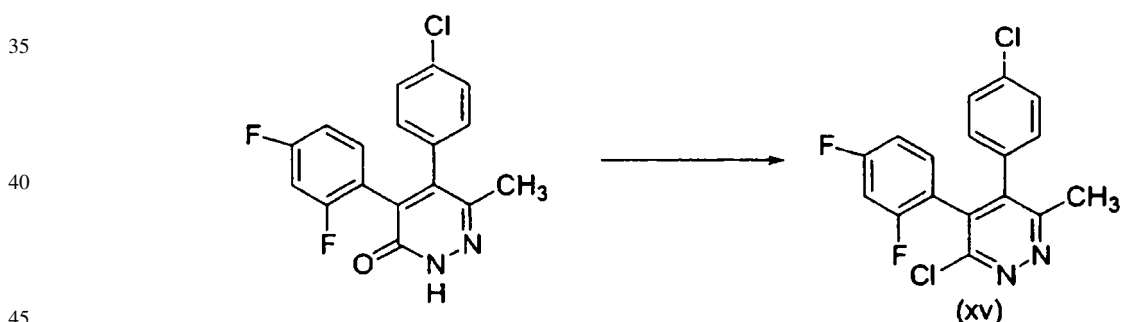


20 Se mezclaron 7,61 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 40 ml de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 4 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 8,52 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (xiv) de la presente invención).

25 Compuesto (xiv) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,75-6,85(2H, m), 6,9-7,0(3H), 7,30(2H, d, J = 8,8 Hz).

30 Ejemplo de producción 14



50 Se mezclaron 1,20 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,9-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 1,22 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (xv) de la presente invención).

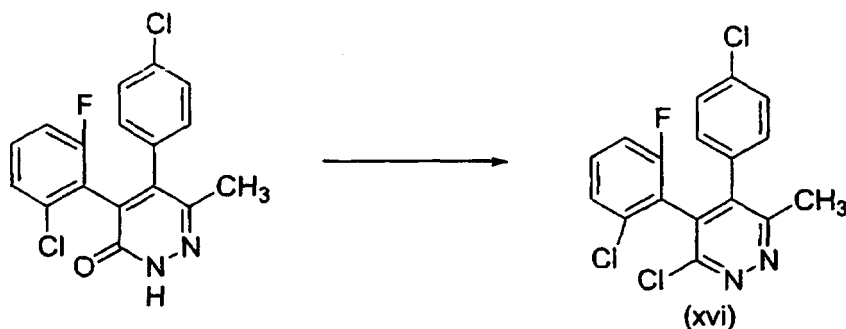
55 Compuesto (xv) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,53(3H, s), 6,75-6,85(2H), 6,9-7,0(3H), 7,29(2H, d, J = 8,8 Hz).

60

65

## Ejemplo de producción 15

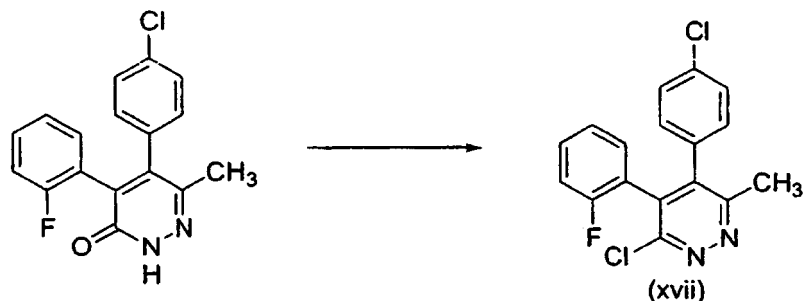


20 Se mezclaron 2,16 g de 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 2,21 g de 3-cloro-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (xvi) de la presente invención).

25 Compuesto (xvi) de la presente invención:

30 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,9-7,0(1H, m), 7,07(2H, d, J = 8,8 Hz), 7,17(1H, d, J = 8,0 Hz), 7,2-7,3(3H).

## Ejemplo de producción 16



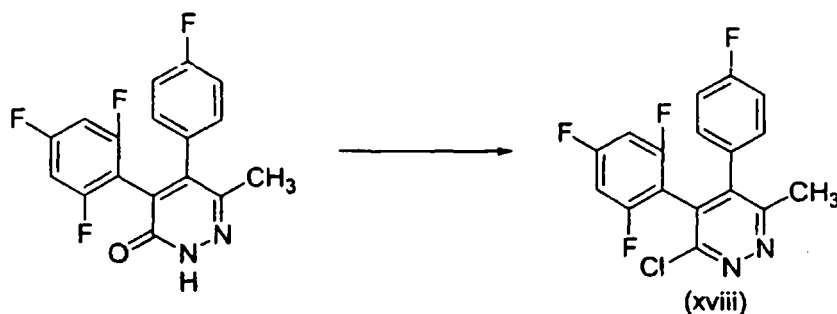
50 Se mezclaron 1,95 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 1,96 g de 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-metilpiridazina (en adelante denominada compuesto (xvii) de la presente invención).

55 Compuesto (xvii) de la presente invención:

60 RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,53(3H, s), 6,95-7,1(5H), 7,25-7,35(3H).

## ES 2 324 883 T3

### Ejemplo de producción 17

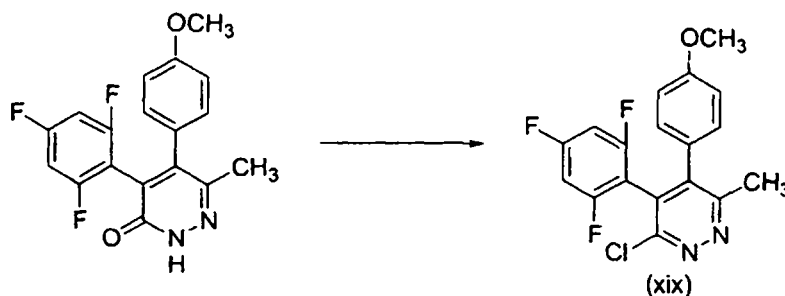


20 Se mezclaron 2,36 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 2,34 g de 3-cloro-5-(4-fluorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-piridazina (en adelante denominada compuesto (xviii) de la presente invención).

25 Compuesto (xviii) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,6-6,65(2H, m), 7,0-7,1(4H, m).

### 30 Ejemplo de producción 18



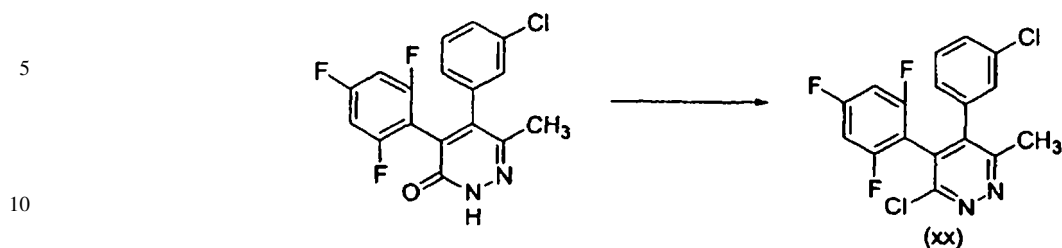
50 Se mezclaron 2,06 g de 5-(4-metoxifenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 2,14 g de 3-cloro-5-(4-metoxifenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (xix) de la presente invención).

55 Compuesto (xix) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,55(3H, s), 3,80(3H, s), 6,55-6,65(2H, m), 6,83(2H, d, J = 8,4 Hz), 6,98(2H, d, J = 8,4 Hz).

## ES 2 324 883 T3

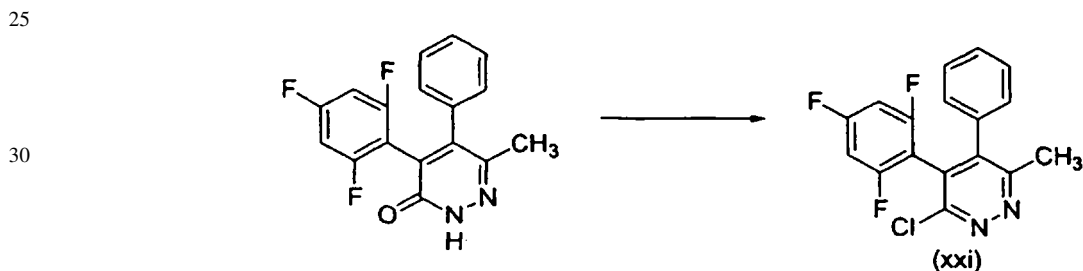
### Ejemplo de producción 19



15 Se mezclaron 2,34 g de 5-(3-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato

20 RMH-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,55(3H, s), 6,6-6,7(2H, br), 6,96(1H, d, J = 7,8 Hz), 7,09(1H), 7,3-7,35(2H).

### Ejemplo de producción 20

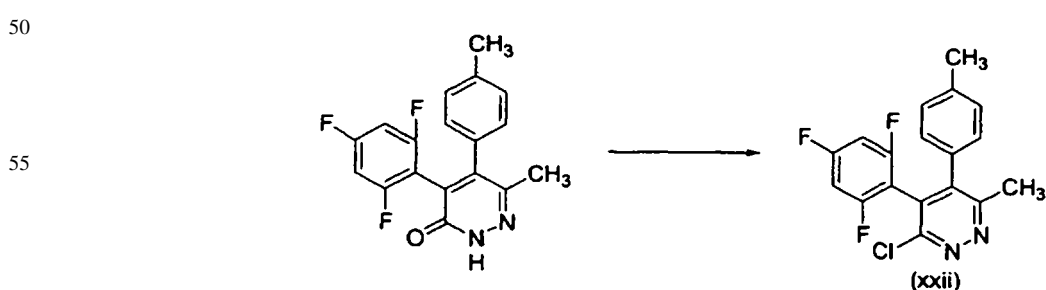


40 Se mezclaron 1,67 g de 6-metil-5-fenil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato

45 Compuesto (xxi) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,54(3H, s), 6,55-6,65(2H, m), 7,05-7,1(2H), 7,3-7,35(3H).

### Ejemplo de producción 21



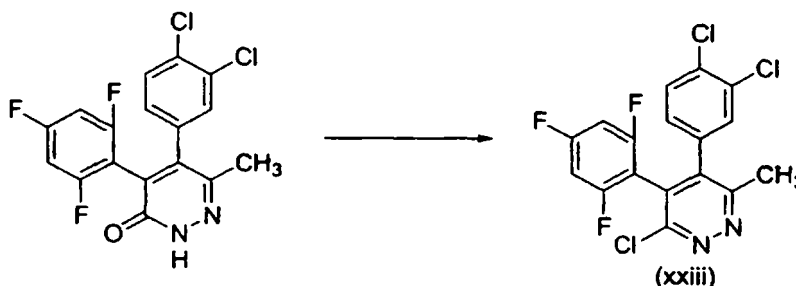
65 Se mezclaron 19,77 g de 6-metil-5-(4-metilfenil)-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 100 ml de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió cloroformo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato

## ES 2 324 883 T3

Compuesto (xxii) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,32(3H, s), 2,55(3H, s), 6,55-6,65(2H, m), 6,94(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,12(2H, d, J = 8,4 Hz).

Ejemplo de producción 22

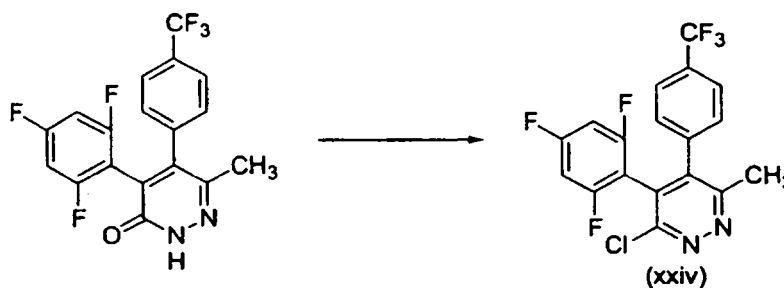


Se mezclaron 1,75 g de 5-(3,4-diclorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 6 ml de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 1,80 g de 3-cloro-5-(3,4-diclorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (xxiii) de la presente invención).

Compuesto (xxiii) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,55(3H, s), 6,67(2H, br t), 6,93(1H, dd), 7,20(1H, d), 7,43(1H, d).

Ejemplo de producción 23



Se mezclaron 2,43 g de 6-metil-5-(4-trifluorometilfenil)-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona y 10 g de oxiclورو de fósforo y se agitaron a 110°C durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriase hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y agua helada, y se separaron dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con agua y solución hipersalina saturada y se secó sobre sulfato sódico anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 2,50 g de 3-cloro-6-metil-5-(4-trifluorometilfenil)-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (en adelante denominada compuesto (xxiv) de la presente invención).

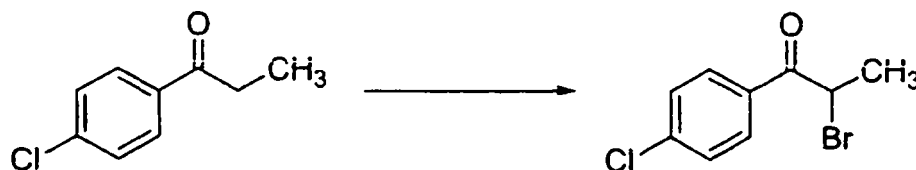
Compuesto (xxiv) de la presente invención:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,53(3H, s), 6,6-6,7(2H, m), 7,23(2H, d, J = 8,0 Hz), 7,62(2H, d, J = 8,0 Hz).

## ES 2 324 883 T3

A continuación, se proporcionan los ejemplos de producción de referencia para la producción de productos intermedios de los compuestos de la presente invención.

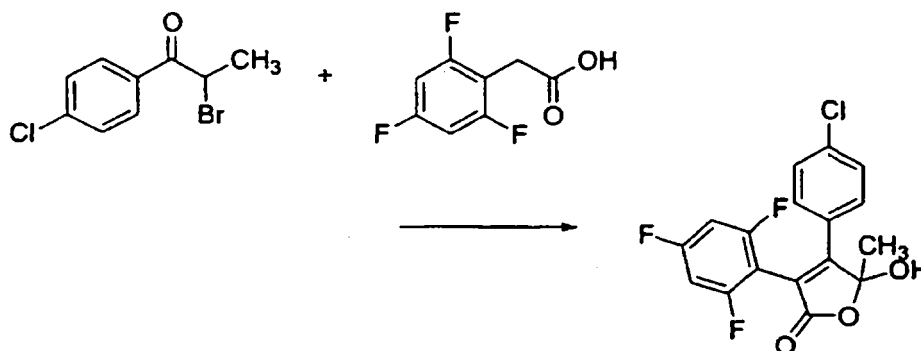
### Ejemplo de producción 1 de referencia



A una mezcla de 10,12 g de 4'-cloropropiofenona, 0,1 ml de ácido hidrobromico (solución acuosa al 48%) y 60 ml de ácido acético, se le añadieron 3,1 ml de bromo a 0°C bajo una atmósfera de nitrógeno, y se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después, la mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida, obteniendo 14,34 g de 2-bromo-4'-cloropropiofenona.

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,90(3H, d, J = 6,5 Hz), 5,22(1H, q, J = 6,5 Hz), 7,46(2H, d, J = 8,7 Hz), 7,97(2H, d, J = 8,7 Hz).

### Ejemplo de producción 2 de referencia



Se mezclaron 14,32 g de 2-bromo-4'-cloropropiofenona, 12,08 g de ácido 2,4,6-trifluorofenilacético, 170 ml de acetonitrilo y 6,43 g de trietilamina y se agitaron a temperatura ambiente durante la noche. A esta mezcla se le añadieron 210 ml de acetonitrilo a temperatura ambiente, después la mezcla se enfrió a 0°C y se añadieron 21,5 g de DBU a lo largo de 25 minutos. La mezcla se agitó durante 2 horas a 0°C. Después, se inyectó aire en la mezcla resultante a temperatura ambiente bajo agitación durante 4,5 horas. A la mezcla de reacción se añadió 1 mol/l de ácido hidrocórico, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó secuencialmente con solución acuosa saturada de bicarbonato sódico y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró bajo presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía de gel de sílice, obteniendo 17,89 g de 4-(4-clorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona.

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm): 1,76 (3H, s), 4,20 (1H, br), 6,63 (1H, br), 6,80 (1H, br), 7,33 (2H, d, J = 8,7 Hz), 7,48 (2H, d, J = 8,7 Hz).

A continuación, se muestran los compuestos producidos de manera similar a la indicada en el presente ejemplo de producción y los datos de RMN de los mismos.

4-(4-clorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,3,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H (DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,66 (3H, s), 7,15-7,4 (1H, br), 7,51 (4H, s), 7,6-7,7 (1H, m), 8,39 (1H, s)

4-(4-clorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,4,5-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,61(3H, s), 7,4-7,65(6H), 8,23(1H, br)

4-(4-clorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,3,5-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,62(3H, s), 7,1-7,2(1H, br), 7,45-7,55(4H), 7,6-7,7 (1H, br), 8,22 (1H,s)

## ES 2 324 883 T3

4-(4-clorofenil)-3-(2,6-difluoro-4-nitrofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,67(3H, s), 7,45-7,55(4H), 8,05-8,3(2H,br), 8,47(1H, s)

5

3-(3-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(4-clorofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H (DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,65(3H, s), 7,28(1H, br), 7,50(4H, s), 7,78(1H, br dd, J = 8,8, 10,4 Hz), 8,40 (1H, br s)

10

4-(4-clorofenil)-3-(2,3-difluorofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H (DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,63(3H, s), 7,15-7,25(1H, m), 7,25-7,35(1H, m), 7,47-7,6(5H), 8,18(1H, s)

15

4-(4-clorofenil)-3-(2,5-difluorofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 1,60(3H, s), 7,15-7,55(7H), 8,15(1H, s)

20

4-(4-clorofenil)-3-(2,6-difluorofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona.

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,73(3H, s), 4,2-4,4(1H, br), 6,75-6,85(1H, m), 6,9-7,0(1H, m), 7,31(2H, d, J = 8,8 Hz), 7,3-7,4(1H, m), 7,45(2H, d, J = 8,8 Hz)

25

4-(4-clorofenil)-3-(2,4-difluorofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,74(3H, s), 3,83(1H, s), 6,75-6,85(1H, m), 6,90-7,0(1H, m), 7,32(2H, d, J = 8,8 Hz), 7,35-7,45(1H, m), 7,46(2H, d, J = 8,8 Hz)

30

4-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-5-hidroxi-5-metil-2(5H)-furanona:

35

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,73(3H, s), 4,37(1H, s), 7,04(1H, t, J=8,8 Hz), 7,17(1H, t, J = 7,8 Hz), 7,28(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,3-7,4(2H), 7,46(2H, d, J = 8,4 Hz)

40

4-(4-fluorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,77(3H, s), 4,42(1H, br s), 6,55-6,95(2H), 7,0-7,1(2H, m), 7,5-7,6(2H, m)

45

5-hidroxi-4-(4-metoxifenil)-5-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,80(3H, s), 3,82(3H, s), 4,16(1H, br), 6,6-6,7(1H, br), 6,75-6,85(1H, m), 6,76 (2H, d, J = 8,8 Hz), 7,54(2H, d, J = 8,8 Hz)

50

4-(3-clorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,77(3H, s), 4,27(1H, br s), 6,65-6,8(2H), 7,25-7,4(3H), 7,57(1H)

55

5-hidroxi-5-metil-4-fenil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,79(3H, s), 4,17(1H, br), 6,65-6,8(2H), 7,3-7,5(3H), 7,5-7,6(2H)

60

5-hidroxi-5-metil-4-(4-metilfenil)-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,80(3H, s), 2,30(3H, s), 3,93(1H, br), 6,6-6,7(1H, br), 6,75-6,9(1H, br), 7,16(2H, d, J = 8 Hz), 7,44(2H, d, J = 8 Hz)

65

## ES 2 324 883 T3

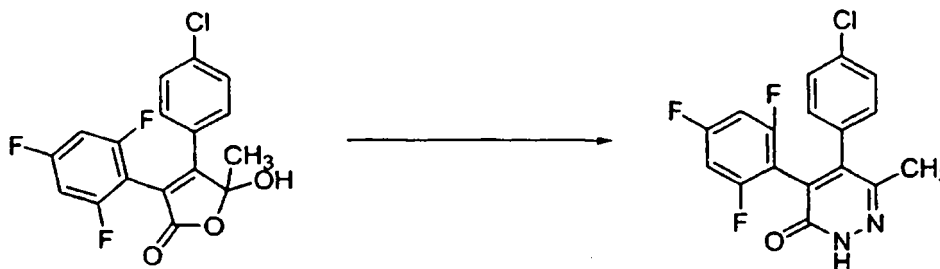
4-(3,4-diclorofenil)-5-hidroxi-5-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,76(3H, s), 4,4-4,8(1H, br), 6,65(1H, br), 6,8(1H, br), 7,31(1H, dd, J = 2,8.4 Hz), 7,42(1H, d, J = 8,4 Hz), 7,70(1H, d, J = 2 Hz)

5-hidroxi-5-metil-4-(4-trifluorometilfenil)-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona:

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1,78(3H, s), 4,05(1H, br s), 6,55-6,9(2H), 6,6-6,7(4H)

Ejemplo de producción 3 de referencia



Se mezclaron 17,03 g de 4-(4-clorofenil)-5-hidroxi-5'-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-2(5H)-furanona, 2,64 g de hidrazina monohidrato y 240 ml de 1-butanol, y se agitaron a 90°C durante 3 horas. A continuación, la mezcla de reacción se enfrió hasta 0°C. El sólido resultante se recogió mediante filtración. El sólido recogido se lavó utilizando hexano y éter t-butilmetílico y se secó bajo presión reducida, obteniendo 6,99 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona.

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,11(3H, s), 6,57(2H, dd, J = 7,3, 8,7 Hz), 7,03(2H, d, J = 8,3 Hz), 7,30(2H, d, J = 8,3 Hz), 11,04(1H, s).

A continuación, se muestran los compuestos producidos de manera similar a la del presente ejemplo de producción y los datos de RMN de los mismos.

5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,3,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 2,06(3H, s), 7,05(1H, br), 7,19(2H, br), 7,35-7,45(3H)

5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,5-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 2,02(3H, s), 7,10-7,45(6H), 13,23(1H, s)

5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,3,5-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 2,03(3H, s), 6,93(1H, br), 7,17(1H, br), 7,33(1H, br), 7,35-7,5(3H), 13,28(1H, s)

5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-nitrofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 2,07(3H, s), 7,20(2H, d, J = 8 Hz), 7,40(2H, d, J = 8 Hz), 7,95-8,05(2H, m)

4-(3-cloro-2,6-difluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,12(3H, s), 6,75-6,8(1H, m), 7,04(2H, d, J = 8,8 Hz), 7,25-7,35(3H), 11,86(1H, br s)

5-(4-clorofenil)-4-(2,3-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H (DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 2,02(3H, s), 6,85-6,95(1H, m), 7,0-7,15(2H), 7,25-7,45(4H), 13,22(1H, s)

## ES 2 324 883 T3

5-(4-clorofenil)-4-(2,5-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS)δ(ppm): 2,01(3H, s), 7,0-7,4(7H), 13,19(1H, s)

5

5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,11(3H, s), 6,65-6,8(2H), 6,9-7,1(3H), 7,25-7,35(2H), 11,24(1H, br)

10

5-(4-clorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,11(3H, s), 6,65-6,8(2H), 6,95(1H, br), 6,95-7,1(2H), 7,2-7,35(2H), 11,82(1H, br s)

15

4-(2-cloro-6-fluorofenil)-5-(4-clorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub> (que contenía una gota de DMSO-d<sub>6</sub>), TMS) δ(ppm): 2,11 y 2,12 (total 3H, cada s), 6,85-6,9(1H, m), 7,05-7,35(6H), 12,37(1H, br s)

20

5-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub> (que contenía una gota de DMSO-d<sub>6</sub>), TMS) δ(ppm): 2,11(3H, s), 6,9-7,1(5H), 7,2-7,3(3H), 12,09(1H, br s)

25

5-(4-fluorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,12(3H, s), 6,5-6,6(2H, m), 6,95-7,1(4H), 11,57(1H, br s)

30

5-(4-metoxifenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,14(3H, s), 3,79(3H, s), 6,5-6,6(2H, m), 6,82(2H, d, J = 8,8 Hz), 7,00(2H, d, J = 8,8 Hz), 10,85(1H, br s)

35

5-(3-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,13(3H, s), 6,5-6,65(2H, br), 6,98(2H, d, J = 7,2 Hz), 7,11(1H, s), 7,25-7,35(2H), 11,97(1H, br s)

40

6-metil-5-fenil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,12(3H, s), 6,45-6,55(2H, m), 7,05-7,1(2H), 7,25-7,35(3H), 11,93(1H, br s)

50

6-metil-5-(4-metilfenil)-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,12(3H, s), 2,31(3H, s), 6,5-6,6(2H, m), 6,96(2H, d, J = 8 Hz), 7,10(2H, d, J = 8 Hz), 10,68(1H, br s)

55

5-(3,4-diclorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,13(3H, s), 6,61(1H, br t), 6,94(1H, dd, J = 2,8,4 Hz), 7,22(1H, d, J = 2 Hz), 7,41(1H, d, J = 8,4 Hz), 10,76(1H, br s)

60

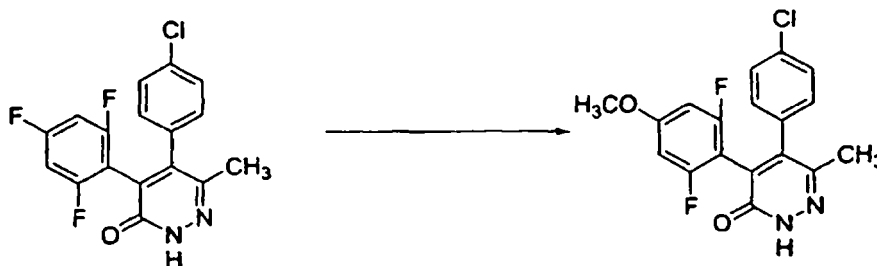
6-metil-5-(4-trifluorometilfenil)-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,10(3H, s), 6,57(2H, dd, J = 7,2, 8,8 Hz), 7,25(2H, d, J = 8,0 Hz), 7,60(2H, d, J = 8,0 Hz), 11,13(1H, br s)

65

## ES 2 324 883 T3

Ejemplo de producción 4 de referencia



Se mezclaron 0,35 g de 5-(4-clorofenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-2H-piridazín-3-ona, 0,96 g de metóxido sódico (solución al 28% en metanol) y 6 ml de metanol, y se agitaron durante 14 horas bajo reflujo con calentamiento. A continuación, se añadieron a la mezcla de reacción 0,96 g de metóxido sódico (solución al 28% en metanol) y se agitó durante 9 horas bajo reflujo con calentamiento. La mezcla de reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, concentrando después bajo presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía de columna de gel de sílice (solvente de elución: hexano + éter terc-butilmetílico), obteniendo 0,25 g de 5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona.

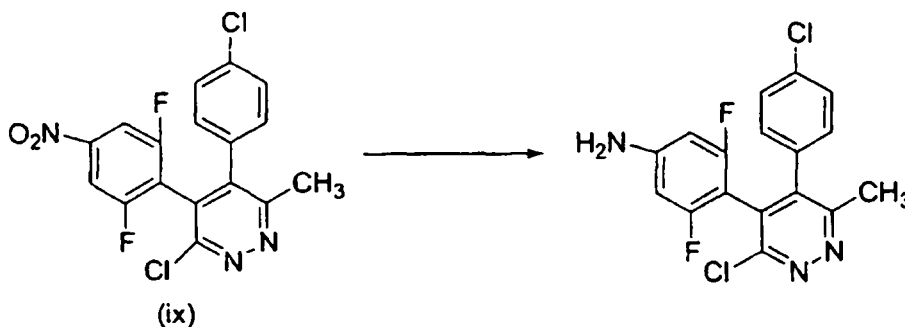
RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ(ppm): 2,11(3H, s), 3,73(3H, s), 6,34(2H, dd, J = 4,12 Hz), 7,04 (2H, d, J = 12 Hz), 7,29 (2H, d, J = 12 Hz), 11,57(1H, br s).

A continuación, se proporcionan los compuestos producidos de manera similar a la del presente ejemplo de producción y los datos de RMN de los mismos.

5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-etoxifenil)-6-metil-2H-piridazín-3-ona

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ(ppm): 1,37(3H, t, J=7,2 Hz), 2,10(3H, s), 3,93(2H, q, J=7,2 Hz), 6,32(2H, dd, J=5,2, 14,4 Hz), 7,04(2H, d, J=8,8 Hz), 7,28(2H, d, J=8,8 Hz), 11,46(1H, br s).

Ejemplo de producción 5 de referencia



Se agitó una mezcla de 3,91 g de hierro (polvos), 60 ml de ácido acético y 60 ml de agua durante 0,5 horas a una temperatura de entre 70°C y 80°C. Sobre esta mezcla se vertió una solución de acetato de etilo (120 ml) de 5,44 g del compuesto (ix) de la presente invención a una temperatura de entre 70°C y 80°C durante 40 minutos. Después, se filtró la mezcla de reacción a través de Celite. El filtrado se separó en dos capas. La capa orgánica se lavó secuencialmente con solución hipersalina saturada, agua saturada con bicarbonato sódico (3 veces) y solución hipersalina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró bajo presión reducida, obteniendo 4,98 g de 4-(4-amino-2,6-difluorofenil)-3-cloro-5-(4-clorofenil)-6-metilpiridazina.

RMN-<sup>1</sup>H(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 2,51(3H, s), 4,00(2H, br s), 6,05-6,15(2H, m), 7,02(2H, d, J = 8,4 Hz), 7,31(2H, d, J = 8,4Hz).

A continuación se proporcionan los ejemplos de Formulación. El término “parte” se refiere a partes en peso.

## ES 2 324 883 T3

### Ejemplo 1 de formulación

Se pulverizaron y mezclaron bien cincuenta partes de cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención, 3 partes de ligninsulfonato de calcio, 2 partes de laurilsulfato de magnesio y 45 partes de sílice hidratado sintético, proporcionando polvos humectables de cada compuesto.

### Ejemplo 2 de formulación

Se mezclaron veinte partes de cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención y 1,5 partes de trioleato de sorbitán con 28,5 partes de una solución acuosa que contenía 2 partes de alcohol polivinílico y se pulverizó en húmedo finamente. A la mezcla obtenida, se le añadieron 40 partes de una solución acuosa que contenía 0,05 partes de goma xantano y 0,1 partes de silicato de aluminio-magnesio y adicionalmente 10 partes de propilenglicol, proporcionando un concentrado en suspensión de cada compuesto.

### Ejemplo 3 de formulación

Se pulverizaron y se mezclaron bien dos partes de cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención, 88 partes de arcilla caolín y 10 partes de talco, proporcionando unos polvos de cada compuesto.

### Ejemplo 4 de formulación

Se mezclaron bien cinco partes de cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención, 14 partes de éter polioxietilenoestirilfenílico, 6 partes de dodecilsulfonato de calcio y 75 partes de xileno, proporcionando un concentrado emulsionable de cada compuesto.

### Ejemplo 5 de formulación

Se pulverizaron y se mezclaron bien dos partes de cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención, 1 parte de sílice hidratado sintético, 2 partes de ligninsulfonato de calcio, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla caolín, y se añadió agua a la mezcla y se amasó, se granuló y se secó, proporcionando gránulos de cada compuesto.

### Ejemplo 6 de formulación

Se mezclaron y se pulverizaron en húmedo finamente diez partes de cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención, 35 partes de carbono blanco que contenía 50% en peso de sulfato de éter polioxietilenoalquilico amónico y 55 partes de agua, proporcionando una formulación de cada compuesto.

A continuación, se demuestra mediante ejemplos de ensayo que el compuesto de la presente invención resulta efectivo para controlar enfermedades de las plantas.

### Ejemplo de ensayo 1

Se llenó una maceta de plástico con fango arenoso, se sembró pepino (cultivar: Sagami, Hanjiro) y se cultivó en un invernadero durante 10 días. Se formuló cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención según el Ejemplo 6 de formulación, después se diluyeron con agua hasta una concentración de 500 ppm. Cada una de las soluciones diluidas resultantes se pulverizó sobre tallos y hojas, de manera que se adhiriese suficientemente a la superficie de los cotiledones de la planta del pepino. Tras la pulverización, la planta se secó al aire, y un recubrió la superficie de los cotiledones de la planta del pepino con un medio PDA que contenía esporas de *Botrytis cinerea*. A continuación, se dejó la planta del pepino bajo condiciones húmedas a 12°C durante 5 días. Después, el área de la lesión de la planta se inspeccionó visualmente. Como resultado, el área de la planta del pepino tratada con los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención era 10% o menos que el área de lesión del pepino no tratado.

### Ejemplo de ensayo 2

Se llenó una maceta de plástico con fango arenoso, se sembró arroz con cáscara (cultivar: NihonBare) y se cultivó en un invernadero durante 15 días. Se formuló cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención según el Ejemplo 6 de formulación, después se diluyeron con agua hasta una concentración de 500 ppm. Cada una de las soluciones diluidas resultantes se pulverizó sobre los tallos y hojas de manera que se adhiriesen suficientemente a la superficie de las hojas de la planta arrocera. Tras la pulverización, la planta se secó al aire. Se situaron macetas de plástico que contenían plantas arroceras afectadas por *Pyricularia oryzae* circundando la maceta de plástico con arroz con cáscara, y se dejó bajo condiciones húmedas a 22°C durante 6 días. Después, se comprobó si se producía un

## ES 2 324 883 T3

efecto de control. Como resultado, el área de lesión del arroz con cáscara tratado con los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención era 10% o menos que el área de lesión del arroz con cáscara no tratado.

### 5 Ejemplo de ensayo 3

Se llenó una maceta de plástico con fango arenoso, se sembró rábano japonés (cultivar: Wase 40 nichii) y se cultivó en un invernadero durante 5 días. Cada uno de los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención se formuló según el Ejemplo 6 de formulación, después se diluyó con agua hasta una concentración de 500 ppm. Cada una de las  
10 soluciones diluidas resultantes se pulverizó sobre tallo y hojas de manera que se adhiriesen suficientemente al rábano. Tras la pulverización, la planta se secó al aire y se inocularon esporas de *Alternaria brassicicola*. A continuación, estos rábanos se dejaron bajo condiciones húmedas a 23°C durante la noche, y después se dejaron en un invernadero durante 3 días. Después, se comprobó si se producía un efecto de control. Como resultado, el área de lesión del rábano  
15 tratado con los compuestos (i) a (xxiv) de la presente invención era 10% o menos que el área de lesión del rábano no tratado.

### Aplicabilidad industrial

20 Las enfermedades de las plantas pueden controlarse mediante la utilización del compuesto de la presente invención.

25

30

35

40

45

50

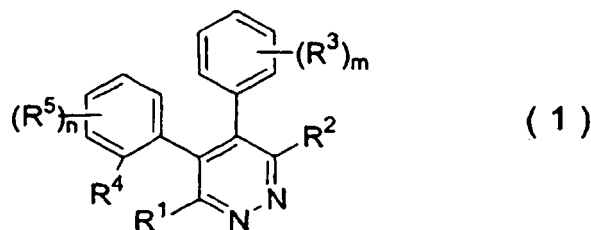
55

60

65

## REIVINDICACIONES

1. Compuesto de piridazina representado por la fórmula (1):



en la que,

20  $R^1$  representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$ ;

$R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ;

25  $R^3$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

$m$  representa un número de 0 a 5, con la condición de que, cuando  $m$  representa un número entero de 2 o más, cada  $R^3$  es igual o diferente;

30  $R^4$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

35  $R^5$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

40  $n$  representa un número entero de 0 a 4; con la condición de que, en el caso de que  $n$  represente un número entero de 2 ó más, cada  $R^5$  es igual o diferente.

2. Compuesto de piridazina según la reivindicación 1, en el que  $m$  es 1 ó 2, y  $n$  es 0, 1 ó 2 en la fórmula (1).

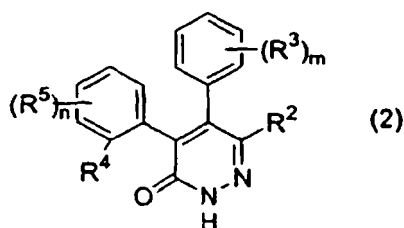
45 3. Compuesto de piridazina según la reivindicación 1 ó 2, en el que  $R^1$  es un átomo de cloro o un átomo de bromo,  $R^2$  es un grupo metilo y  $R^4$  es un átomo de halógeno en la fórmula (1).

4. Composición fungicida que comprende el compuesto de piridazina según la reivindicación 1 como ingrediente activo.

50 5. Procedimiento para controlar las enfermedades de las plantas, que comprende una etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto de piridazina según la reivindicación 1 a plantas o suelos de cultivo de las plantas.

6. Utilización del compuesto de piridazina según la reivindicación 1 como ingrediente activo de una composición fungicida.

55 7. Compuesto representado por la fórmula (2):



## ES 2 324 883 T3

en la que,

$R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ;

5  $R^3$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

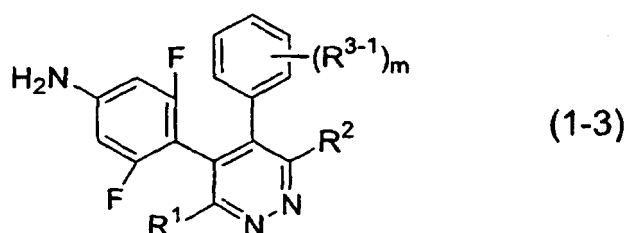
10  $m$  representa un número entero de 0 a 5, con la condición de que, cuando  $m$  representa un número entero de 2 o más, cada  $R^3$  es igual o diferente;

15  $R^4$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

15  $R^5$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

20  $n$  representa un número entero de 0 a 4, con la condición de que, cuando  $n$  representa un número entero de 2 ó más, cada  $R^5$  es igual o diferente.

25 8. Compuesto representado por la fórmula (1-3):



en la que,

40  $R^1$  representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$ ;

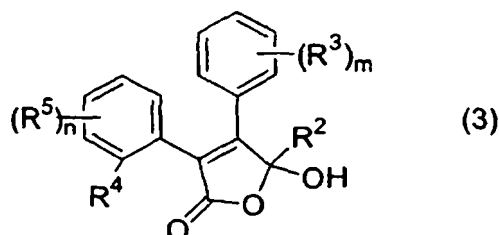
$R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ;

45  $R^{3-1}$  representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

$m$  representa un número entero de 0 a 5, con la condición de que, cuando  $m$  representa un número entero de 2 ó más, cada  $R^{3-1}$  es igual o diferente.

50

9. Compuesto representado por la fórmula (3):



65 en la que,

$R^2$  representa un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ;

## ES 2 324 883 T3

$R^3$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno, un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alquiltio  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

5  $m$  representa un número entero de 0 a 5; con la condición de que, cuando  $m$  representa un número entero de 2 ó más, cada  $R^3$  es igual o diferente;

10  $R^4$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

15  $R^5$  representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno o un grupo alcoxi  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con por lo menos un átomo de halógeno;

$n$  representa un número entero de 0 a 4; con la condición de que, cuando  $n$  representa un número entero de 2 ó más, cada  $R^5$  es igual o diferente.

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65