



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PCT

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones



11-9281

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION



21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO Derivados de hidroximoil-tetrazol
Fungicidas

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE Bayer Cropscience AG.

DOMICILIO Alemania

74. APODERADO Alvaro Correa Ochoa

22. BOGOTÁ, D.C., 27 de enero de 2011.

(FORMA P-10)

04-02-2011

PETITORIO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-009281-00000-0000

Fecha: 2011-01-27 17:17:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR.
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 103

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

1

SOLICITUD DE :

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

2

SOLICITANTE

(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG

Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim Am Rhein, Alemania

Nacionalidad o Domicilio: Alemania

Lugar de Constitución: Alemania

Teléfono: Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No. 10-62 Piso 5

Teléfono: 6341500 Fax: 3762211

E-Mail: alvaro.correa@bakermckenzie.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual

Número 79.143.366 Usaquén TP 20281

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

4

INVENTOR (ES)

(72)

Nombre: BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; BERNIER, David; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DESBORDES, Philippe; DUBOST, Christophe; GENIX, Pierre; PORTZ, Daniela; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike

Dirección: 4 allée Jean Lacarelle F-69230 Saint Genis Laval (FR); Amselstrasse 7 42799 Leichlingen (DE); 38 quai Joseph Gillet F-69004 Lyon (FR); 18 rue de la Quarantaine F-69005 Lyon (FR); 56 cours de la Liberté F-69003 Lyon (FR); 14 rue du Docteur Mouisset F-69006 Lyon (FR); 13 rue Villeneuve F-69004 Lyon (FR); 10 rue Janin F-69004 Lyon (FR); Nikolausstrasse 27 52391 Vettweiss (DE); Oberer Markenweg 85 56566 Neuwied (DE).

Nacionalidad o Domicilio: BEIER, Christian (Alemania); BENTING, Jürgen (Alemania); BERNIER, David (Francia); CHRISTIAN, Isabelle (Francia); COQUERON, Pierre-Yves (Francia); DESBORDES, Philippe (Francia); DUBOST (Francia), Christophe; GENIX, Pierre (Francia); PORTZ, Daniela (Alemania); WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike ((Alemania).

5 PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2009/058427

Fecha 03/07/2009

Publicación Internacional No. WO2010/000841

Fecha 07/01/2010

6 Título (54)

Derivados de hidroximoi-tetrazol fungicidas

7

Clasificación Internacional (51)

C07D 401/12 (2006.01); A01N 43/78 (2006.01); A01N 43/713 (2006.01)

8

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒

NO ☐

EP

04/07/2008

08356101.9

9

Comprobante de pago No. 11-003556

Fecha: 13 de enero de 2011

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

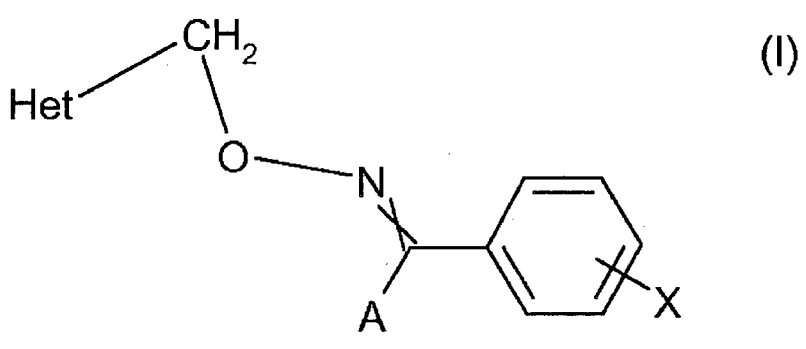
10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, si fuere el caso
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☒ Arte final 12 x 12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☒ Otros: Formato PCT/IB/306 y Extractos

11

FIGURA CARATERISTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDONEZ

FIRMA:

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

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

3
2011/001

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 003556

Bogotá D.C., 13 de 2011 - 17:00:38

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE

NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	353200315	12/01/2011	148.414.500.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1. TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	571.000.00	571.000.00
				\$571.000.00

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

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-009281- -00000-0000

Fecha: 2011-01-27 17:17:34
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 411 PRESENTACIONDep. 2020 DIR. NUEVAS CR.
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 103

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Enero 13 de 2011 - 17:01:27

Poder de Abogado
Ver Traducción al español en el documento original adjunto.
Dado y firmado en
El 12 de Marzo de 2008

No. 388 del registro del documento para el 2008

Por la presente verifico las firmas de

Dr. Robert Krieg
y
Dr. Alexander Nowak

cuya dirección registrada es como sigue:

Bayer CropScience AG
Planificación y Administración de Negocios
Legales & Patentes
Patentes y Licencias
Building 6100
Alfred-Noble Straße 50
40789 Monheim, Alemania

quienes son individualmente representantes autorizados de Bayer CropScience AG y a quienes conozco personalmente

que fueron suscritas ante mí en la página anterior debajo del nombre impreso de la compañía; y confirmo que después de inspeccionar el registro comercial del tribunal local de Dusseldorf, están registrados en la Sección HRB 46985 como representantes individualmente autorizados.

También certifico que Bayer CropScience AG, involucrada en esta certificación, es una compañía activa y existente como entidad legal.

Leverkuseen, Marzo 12 de 2008

Sellos: 1) sello lacrado blanco en alto relieve que dice: KLAUS STRIEWSKI –
NOTARIO EN LEVERKUSEN

2) sello impreso en azul que dice: KLAUS STRIEWSKI –
NOTARIO EN LEVERKUSEN

Signe Apostilla con traducción oficial adjunta



Resolución
6694/78
Minjusticia

Clementina Paredes Tejeda
TRADUCTORA OFICIAL
ENGLISH - FRENCH - SPANISH
ANGLAIS - FRANÇAIS - ESPAGNOL

APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. País: Rep. Federal de Alemania

El presente documento público

2. ha sido firmado por Klaus Striewski

3. actuando en calidad de: notario público

4. lleva el sello / estampilla de: notario Klaus Striewski en Leverkusen

Certificado

5. en: Colonia

6. el: 20 de marzo de 2008

7. por: el vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No.: 1424/08

9. Sello:

10. Firmado:



Caliebe

Adolf Watzke

Traductor oficial

Doc. 2423 Min. Justicia



POWER OF ATTORNEY

The undersigned.

BAYER CROPSCIENCE AG

domiciled in

Alfred-Nobel-Strasse 50,
40789 Monheim Am Rhein
Germany

declares that it hereby grants to

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

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

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

Done and subscribed in

On the 12th of 2008

Signature of the person issuing



PODER DE ABOGADO

La abajo firmada,

BAYER CROPSCIENCE AG

domiciliada en

Alfred-Nobel-Strasse 50,
40789 Monheim Am Rhein
Alemania

declara por el presente que otorga a

**ALVARO CORREA-ORDOÑEZ y/o
OLGA GEORGETTE OTERO y/o
RICARDO METKE y/o
JUAN PABLO CONCHA**

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

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

Dado y firmado en

A los 12 días del mes de Marzo de 2008

Firma de la persona que firma el Poder

No. 388 of the document register for 2008

I herewith verify the signatures of

Dr. Robert Krieg
and
Dr. Alexander Nowak

of the following business address:
Bayer CropScience AG
Business Planning and Administration
Law & Patents
Patents and Licensing
Building 6100
Alfred-Nobel-Straße 50
40789 Monheim, Germany

who are severally authorised representatives of
Bayer CropScience AG and are known personally to me

which were subscribed today in my presence of the previous page beneath the typewritten company name, and confirm that, having today inspected the commercial register of the local court in Düsseldorf, are recorded in Section HRB 46985 as severally authorised representatives.

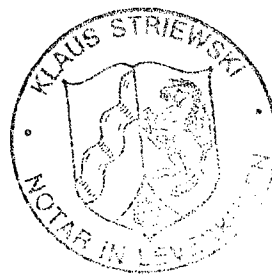
I verify that Bayer CropScience AG involved in this certification is active and exists as legal entity.

Leverkusen, den 12. März 2008



A large, stylized handwritten signature in black ink.

Notary Public



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2. ist unterschrieben von **Klaus Striewski**

3. in seiner Eigenschaft als **Notar**

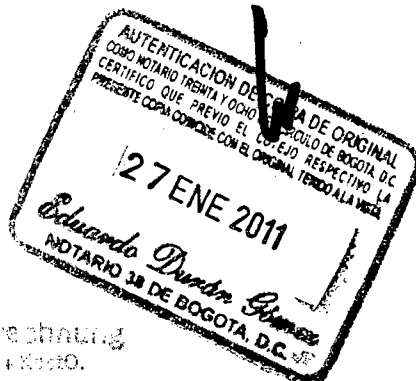
4. Sie ist versehen mit dem Siegel des
Notars Klaus Striewski in Leverkusen

Bestätigt

5. in Köln
6. am 20.03.2008
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln
8. unter Nr. 1424/08
9. Stempel
10. Unterschrift

Caliebe

Caliebe



Rechnung
Nr. 1424/08
1. 10,00 (1) EUR 10,00
2. 10,00 EUR 10,00
Ges. 20,00 EUR 20,00
Zus. 69,02
Zus. EUR 69,02

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

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

Date of mailing (day/month/year)

02 June 2010 (02.06.2010)

Applicant's or agent's file reference

BCS 08-4011

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/EP2009/058427

International filing date (day/month/year)

03 July 2009 (03.07.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

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

State of Nationality

FR

State of Residence

FR

Telephone No.

Facsimile No.

E-mail address

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

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

Name and Address

BAYER CROPSCIENCE AG
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

E-mail address

☐ Notifications by e-mail authorized

3. Further observations, if necessary:

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

☒ the receiving Office
☐ the International Searching Authority
☐ the Authority(ies) specified for supplementary search☐ the International Preliminary Examining Authority
☒ the designated Offices concerned
☐ the elected Offices concerned
☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Blanc Veronique

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail PT05.PCT@WIPO.INT

Telephone No. +41 22 338 74 05



(51) International Patent Classification:
C07D 401/12 (2006.01) A01N 43/713 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)

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

(21) International Application Number:
PCT/EP2009/058427

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

(22) International Filing Date:
3 July 2009 (03.07.2009)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
08356101.9 4 July 2008 (04.07.2008) EP

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

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): BEIER, Christian
[DE/FR]; 4 allée Jean Lacarelle, F-69230 Saint Genis
Laval (FR). BENTING, Jürgen [DE/DE]; Amselstrasse
7, 42799 Leichlingen (DE). BERNIER, David [FR/FR];
38 quai Joseph Gillet, F-69004 Lyon (FR). CHRISTIAN,
Isabelle [FR/FR]; 18 rue de la Quarantaine, F-69005
Lyon (FR). COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 56
cours de la Liberté, F-69003 Lyon (FR). DESBORDES,
Philippe [FR/FR]; 14 rue du Docteur Mouisset, F-69006
Lyon (FR). DUBOST, Christophe [FR/FR]; 13 rue Vil-
leneuve, F-69004 Lyon (FR). GENIX, Pierre [FR/FR];
10 rue Janin, F-69004 Lyon (FR). PORTZ, Daniela [DE/
DE]; Nikolausstrasse 27, 52391 Vettweiss (DE).
WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE];
Oberer Markweg 85, 56566 Neuwied (DE).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV,
MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM,
TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

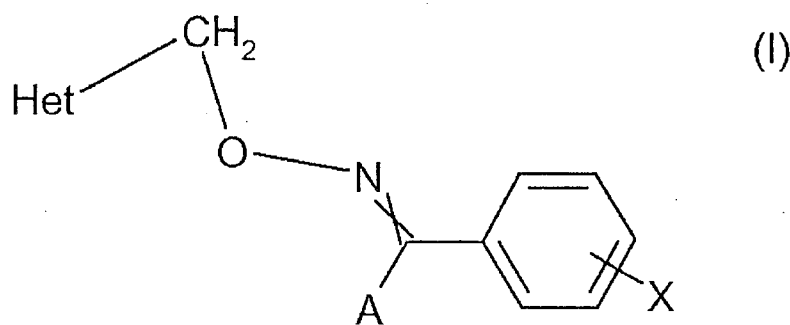
Declarations under Rule 4.17:

- as to applicant's entitlement to apply for and be granted
a patent (Rule 4.17(ii))
- of inventorship (Rule 4.17(iv))

Published:

- with international search report (Art. 21(3))

(54) Title: FUNGICIDE HYDROXIMOYL-TETRAZOLE DERIVATIVES



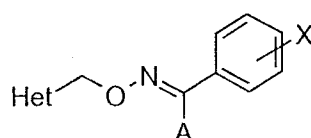
(57) Abstract: The present invention relates to hydroximoyl-tetrazole derivatives of formula (I), their process of preparation, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions. Formula (I) wherein A represents a tetrazolyl group, Het represents a pyridyl group or a thiazolyl group and X represents various substituents.

FUNGICIDE HYDROXIMOYL-TETRAZOLE DERIVATIVES

DESCRIPTION

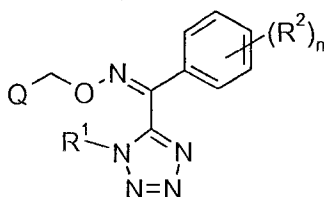
5 The present invention relates to hydroximoyl-tetrazole derivatives, their process of preparation, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.

10 In European patent application n°1426371, there are disclosed certain tetrazoyloxime derivatives of the following chemical structure:



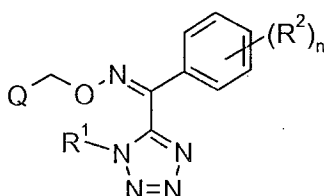
wherein A represents a tetrazolyl group, Het represents either a particular pyridinyl group or a particular thiazolyl group.

15 In Japanese patent application n°2004-131392, there are disclosed certain tetrazoyloxime derivatives of the following chemical structure:



wherein Q can be selected in a list of 15 various heterocycle groups.

In Japanese patent application n°2004-131416, there are disclosed certain tetrazoyloxime derivatives of the following chemical structure:



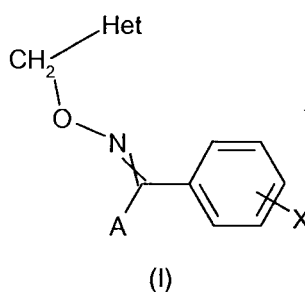
20 wherein Q can be selected among a pyridinyl group or a thiazolyl group.

The compounds disclosed in these three documents do not prove to provide a comparable utility than the compounds according to the invention.

25 It is always of high-interest in agriculture to use novel pesticide compounds in order to avoid or to control the development of resistant strains to the active ingredients. It is also of high-interest to use novel compounds being more active than those already known, with the aim of decreasing the amounts of active

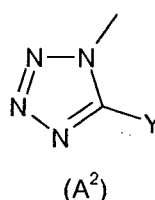
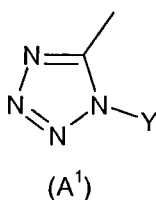
compound to be used, whilst at the same time maintaining effectiveness at least equivalent to the already known compounds. We have now found a new family of compounds which possess the above mentioned effects or advantages.

5 Accordingly, the present invention provides a tetrazoyloxime derivative of formula (I)



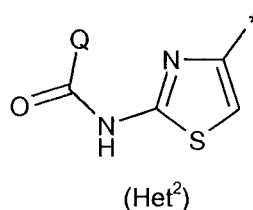
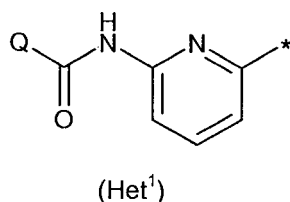
wherein

- X represents a hydrogen atom, a halogen atom, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, a cyano group, a methanesulfonyl group, a nitro group, a trifluoromethyl group or an aryl group ;
- A represents a tetrazoyl group of formula (A¹) or (A²):



wherein Y represents substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl; and

- Het represents a pyridyl group of formula (Het¹) or a thiazolyl group of formula (Het²) ;



wherein

- Q represents a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₃-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted aryl-cyclopropyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl-C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-

substituted C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted benzyloxy, substituted or non-substituted phenoxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; [substituted aryl]-[C₁-C₈]-alkyl; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-halogenoalkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S and having 1 to 5 halogen atoms; substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)-silyloxy, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkenyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkyl-[C₁-C₈]-alkyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkenyl-[C₁-C₈]-alkyl, substituted or non-substituted arylcarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclylcarbonyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes and metalloidic complexes thereof or (E) and (Z) isomers and mixtures thereof.

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

Notably, the stereostructure of the oxime moiety present in the heterocyclyloxime derivative of formula (I) includes (E) or (Z) isomer, and these stereoisomers form part of the present invention.

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

- halogen means fluorine, chlorine, bromine or iodine ;
- heteroatom can be nitrogen, oxygen or sulphur ;
- unless indicated otherwise, a group or a substituent that is substituted according to the invention can be substituted by one or more of the following groups or atoms: a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulphenyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulphenyl group, a formyl group, a substituted or non-substituted carbaldehyde O-(C₁-C₈-

alkyl)oxime, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a formylamino group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-cycloalkyl, tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-alkynyloxy, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbonylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a di-C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₈-alkoxyalkyl, C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulphenyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulphenyl, or phenylamino ;

- the term "aryl" means phenyl or naphthyl;
- the term "heterocyclyl" means saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered ring comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S.

Preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein X represents a hydrogen atom, a halogen atom, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, a cyano group, a methanesulfonyl group, a nitro group, a trifluoromethyl group or an aryl group.

Among the halogen atoms represented for X, a chlorine atom or a fluorine atom is particularly preferred.

The substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl group represented for X is preferably an alkyl group having 1 to 4 carbon atoms and specific examples thereof include a methyl group, an ethyl group, an n-propyl group, an isopropyl group, an n-butyl group, an isobutyl group, a sec-butyl group, and a tert-butyl group. Among these alkyl groups, a methyl group or a tert-butyl group is particularly preferred.

The alkoxy group for X is preferably a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy group having 1 to 3 carbon atoms and specific examples thereof include a methoxy group, an ethoxy group, a propoxy group, and an isopropoxy group. Among these alkoxy groups, a methoxy group or an ethoxy group is particularly preferred.

- 5 Even more preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein X represents a hydrogen atom.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Y represents a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl group. Among these alkyl groups, an alkyl group having 1 to 3 carbon atoms such as a methyl group, an ethyl group, an n-propyl group or an isopropyl group is preferable. Among these alkyl groups, a methyl group is particularly preferred.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q represents a substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted benzyloxy, substituted or non-substituted phenoxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-halogenoalkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S and having 1 to 5 halogen atoms; substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkenyl.

More preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q represents a substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted benzyloxy, substituted or non-substituted phenoxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S.

Even more preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q represents a substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S

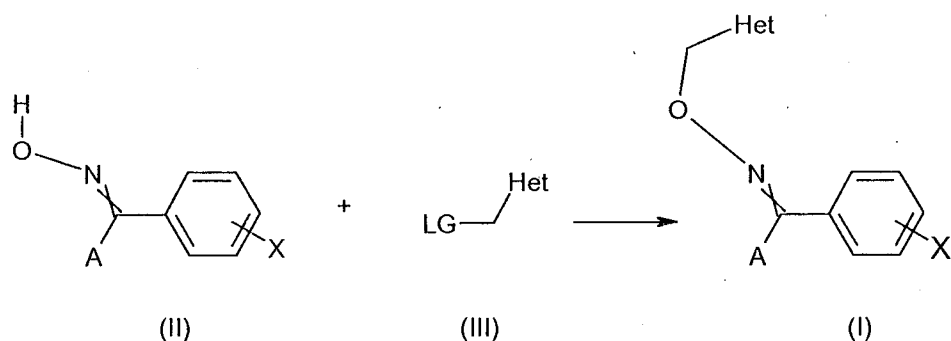
Even more particularly preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q represents a substituted or non-substituted C₅-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₄-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₄-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxy-[C₁-C₃]-alkyl, substituted or non-substituted C₄-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₄-C₈-alkynyloxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S.

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

- preferred features of X with preferred features of one or more of A¹, A², Y, Het¹, Het² and Q ;
- preferred features of A¹ with preferred features of one or more of X, A², Y, Het¹, Het² and Q ;
- preferred features of A² with preferred features of one or more of X, A¹, Y, Het¹, Het² and Q ;
- preferred features of Y with preferred features of one or more of X, A², A¹, Het¹, Het² and Q ;
- preferred features of Het¹ with preferred features of one or more of X, A¹, A², Y, Het² and Q ;
- preferred features of Het² with preferred features of one or more of X, A¹, A², Y, Het¹ and Q ;
- preferred features of Q with preferred features of one or more of X, A¹, A², Y, Het¹ and Het².

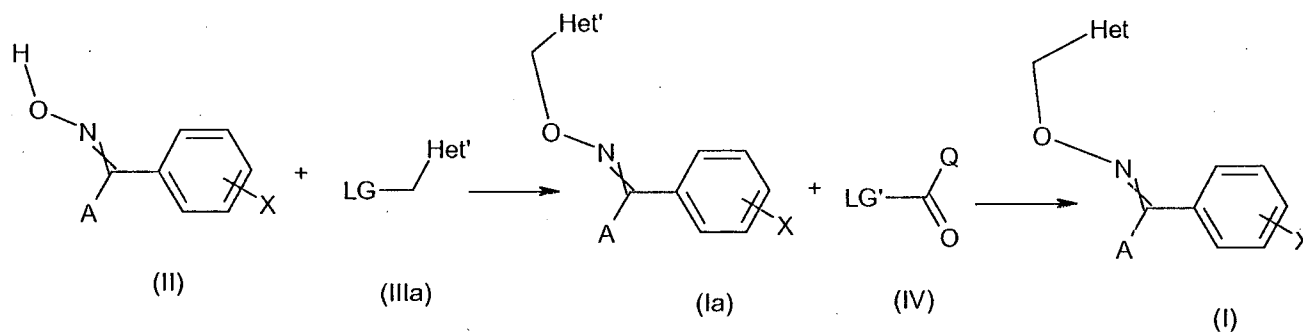
In these combinations of preferred features of the substituents of the compounds according to the invention, the said preferred features can also be selected among the more preferred features of each of X, A¹, A², Y, Het¹, Het² and Q ; so as to form most preferred subclasses of compounds according to the invention.

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

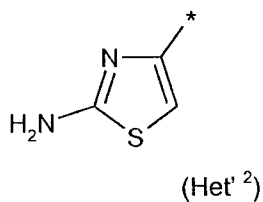
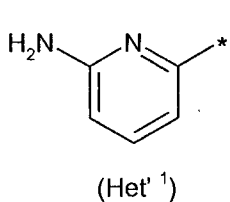
Process P1

wherein A, X, Z, Q and Het are as herein-defined and LG represents a leaving group. Suitable leaving groups can be selected in the list consisting of a halogen atom or other customary nucleofugal groups such as triflate, mesylate or tosylate.

For the compounds of formula (I) according to the invention, there is provided a second process P2 to yield to a compound of formula (I), according to known methods. In such a case there is provided a process P2 according to the invention and such a process P2 can be illustrated by the following reaction scheme :

Process P2

wherein A, X, Q are as herein-defined, Het' represents a pyridyl group of formula (Het' ¹) or a thiazolyl group of formula (Het' ²) ;



wherein LG' represents a leaving group. Suitable leaving groups can be selected in the list consisting of a halogen atom or other customary nucleofugal groups such as alcoholate, hydroxide, carboxylate or cyanide.

For the compounds of formula (Ia), carrying out process P2 would previously require a deprotection step in order to yield the amino group. Amino-protecting groups and related methods of cleavage thereof are known and can be found in T.W. Greene and P.G.M. Wuts, *Protective Group in Organic Chemistry*, 3rd ed., John Wiley & Sons.

According to the invention, processes P1 and P2 can be performed if appropriate in the presence of a solvent and if appropriate in the presence of a base.

According to the invention, processes P1 and P2 can be performed if appropriate in the presence of a catalyst. Suitable catalyst can be selected in the list consisting of 4-dimethyl-aminopyridine, 1-hydroxy-benzotriazole or dimethylformamide.

In case LG' represents a hydroxy group, process P2 according to the present invention can be performed in the presence of condensing agent. Suitable condensing agent can be selected in the list consisting of acid halide former, such as phosgene, phosphorous tri-bro-mide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; anhydride former, such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methanesulfonyl chloride; carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or other customary condensing agents, such as phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyl-diimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane, 4-(4,6-dimethoxy[1.3.5]triazin-2-yl)-4-methylmorpholinium chloride hydrate or bromo-tripyrrolidino-phosphonium-hexafluorophosphate.

Suitable solvents for carrying out processes P1 and P2 according to the invention are customary inert organic solvents. Preference is given to using optionally halogenated aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; chlorobenzene, dichlorobenzene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, dichloroethane or trichloroethane; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl tert-butyl ether, methyl tert-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or iso-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; esters, such as methyl acetate or ethyl acetate, sulfoxides, such as dimethyl sulfoxide, or sulphones, such as sulfolane.

Suitable bases for carrying out processes P1 and P2 according to the invention are inorganic and organic bases which are customary for such reactions. Preference is given to using alkaline earth metal, alkali metal hydride, alkali metal hydroxides or alkali metal alkoxides, such as sodium hydroxide, sodium hydride, calcium hydroxide, potassium hydroxide, potassium tert-butoxide or other ammonium hydroxide, alkali metal carbonates, such as sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium

bicarbonate, cesium carbonate, alkali metal or alkaline earth metal acetates, such as sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, diisopropylethylamine, tributylamine, *N,N*-dimethylaniline, pyridine, *N*-methylpiperidine, *N,N*-dimethylaminopyridine, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octane (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-ene (DBN) or 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene (DBU).

When carrying out processes P1 and P2 according to the invention, the reaction temperature can independently be varied within a relatively wide range.

Generally, process P1 according to the invention is carried out at temperatures between -20°C and 160°C.

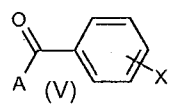
Processes P1 and P2 according to the invention are generally independently carried out under atmospheric pressure. However, it is also possible to operate under elevated or reduced pressure.

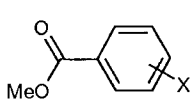
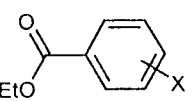
When carrying out process P1 according to the invention, generally 1 mol or an excess of derivative of formula Het-CH₂-LG and from 1 to 3 mol of base are employed per mole of hydroximoyl tetrazole of formula (II). It is also possible to employ the reaction components in other ratios.

Work-up is carried out by customary methods. Generally, the reaction mixture is treated with water and the organic phase is separated off and, after drying, concentrated under reduced pressure. If appropriate, the remaining residue can be freed by customary methods, such as chromatography or recrystallization, from any impurities that can still be present.

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

When A represents a substituent of formula A¹, as herein-described, the compounds of formula (II), useful as a starting material, can be prepared, for example, by reacting hydroxylamine with the corresponding

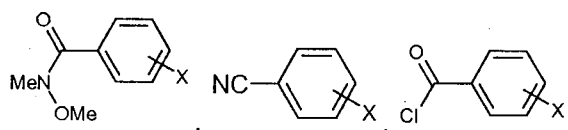
ketones of formula (V)  that can be prepared, for example, according to the method described by R. Raap (*Can. J. Chem.* 1971, 49, 2139) by addition of a tetrazolyl lithium species to esters

of formula  or  or any of their suitable synthetic equivalents like, for example :

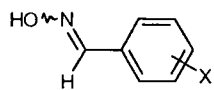
WO 2010/000841

10

PCT/EP2009/058427

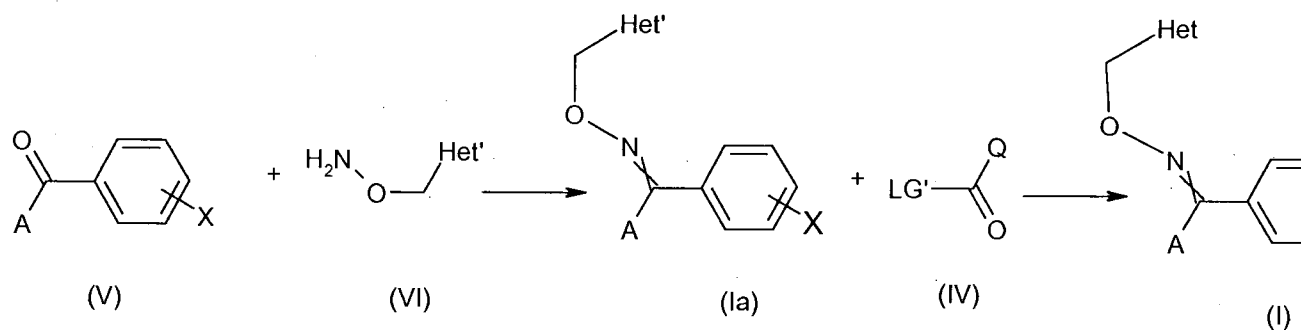


When A represents a substituent of formula A², as herein-described, the compounds of general formula (II) useful as a starting material, can be prepared, for example, from oximes of formula



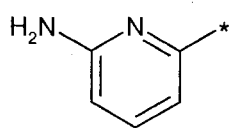
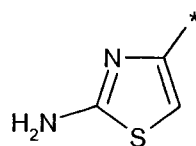
and 5-substituted tetrazole according to the method described by J. Pleniewicz et al. (*Bull. Soc. Chim. Belg.* 1987, 96, 675).

The present invention also relates to a novel process for the preparation of compounds of formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention, there is a provided process P3 for the preparation of compounds of formula (I), as herein-defined, as illustrated by the following reaction scheme:



Process P3

wherein A, X, Q are as herein-defined, Het' represents a pyridyl group of formula (Het'¹) or a thiazolyl group of formula (Het'²);

(Het'¹)(Het'²)

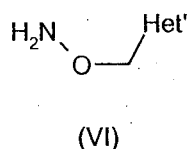
and LG' represents a leaving group.

Suitable leaving groups can be selected in the list consisting of a halogen atom or other customary nucleofugal groups such as alcoholate, hydroxide, carboxylate or cyanide.

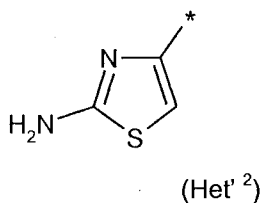
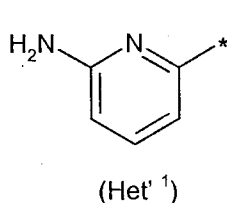
The first step of process P3 according to the invention, namely, the conversion of compound of formula (V) into a compound of formula (Ia) is carried out at temperatures between 110°C and 180°C.

When carrying out the first step of process P3 according to the invention, namely, the conversion of compound of formula (V) into a compound of formula (Ia), the reaction is performed under microwave irradiation.

In a further aspect, the present invention relates to compounds of formula (VI) or one of its salts useful as intermediate compounds or materials for the process of preparation P3 according to the invention. The present invention thus provides compounds of formula (VI)



or one of its salts wherein Het' represents a pyridyl group of formula (Het' ¹) or a thiazolyl group of formula (Het' ²):



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

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

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

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

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

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

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

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

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

comprising a mixture of a compound of formula (I) with a bactericide compound can also be particularly advantageous

According to another object of the present invention, there is provided a method for controlling the
5 phytopathogenic fungi of plants, crops or seeds, characterized in that an agronomically effective and substantially non-phytotoxic quantity of a pesticide composition according to the invention is applied as seed treatment, foliar application, stem application, drench or drip application (chemigation) to the seed, the plant or to the fruit of the plant or to soil or to inert substrate (e.g. inorganic substrates like sand, rockwool, glasswool; expanded minerals like perlite, vermiculite, zeolite or expanded clay), Pumice,
10 Pyroclastic materials or stuff, synthetic organic substrates (e.g. polyurethane) organic substrates (e.g. peat, composts, tree waste products like coir, wood fibre or chips, tree bark) or to a liquid substrate (e.g. floating hydroponic systems, Nutrient Film Technique, Aeroponics) wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.

The expression "are applied to the plants to be treated" is understood to mean, for the purposes of the
15 present invention, that the pesticide composition which is the subject of the invention can be applied by means of various methods of treatment such as:

- spraying onto the aerial parts of the said plants a liquid comprising one of the said compositions,
- dusting, the incorporation into the soil of granules or powders, spraying, around the said plants and in the case of trees injection or daubing,
- 20 • coating or film-coating the seeds of the said plants with the aid of a plant-protection mixture comprising one of the said compositions.

The method according to the invention can either be a curing, preventing or eradicating method.

In this method, a composition used can be prepared beforehand by mixing the two or more active compounds according to the invention.

25 According to an alternative of such a method, it is also possible to apply simultaneously, successively or separately compounds (A) and (B) so as to have the conjugated (A)/(B) effects, of distinct compositions each containing one of the two or three active ingredients (A) or (B).

The dose of active compound usually applied in the method of treatment according to the invention is
30 generally and advantageously

- for foliar treatments: from 0.1 to 10,000 g/ha, preferably from 10 to 1,000 g/ha, more preferably from 50 to 300g/ha; in case of drench or drip application, the dose can even be reduced, especially while using inert substrates like rockwool or perlite;
- for seed treatment: from 2 to 200 g per 100 kilogram of seed, preferably from 3 to 150 g per 100
35 kilogram of seed;
- for soil treatment: from 0.1 to 10,000 g/ha, preferably from 1 to 5,000 g/ha.

The doses herein indicated are given as illustrative Examples of method according to the invention. A person skilled in the art will know how to adapt the application doses, notably according to the nature of the plant or crop to be treated.

Under specific conditions, for example according to the nature of the phytopathogenic fungus to be treated or controlled, a lower dose can offer adequate protection. Certain climatic conditions, resistance or other factors like the nature of the phytopathogenic fungi or the degree of infestation, for example, of the plants with these fungi, can require higher doses of combined active ingredients. The optimum dose usually depends on several factors, for example on the type of phytopathogenic fungus to be treated, on the type or level of development of the infested plant, on the density of vegetation or alternatively on the method of application.

Without it being limiting, the crop treated with the pesticide composition or combination according to the invention is, for example, grapevine, but this could be cereals, vegetables, lucerne, soybean, market garden crops, turf, wood, tree or horticultural plants.

The method of treatment according to the invention can also be useful to treat propagation material such as tubers or rhizomes, but also seeds, seedlings or seedlings pricking out and plants or plants pricking out. This method of treatment can also be useful to treat roots. The method of treatment according to the invention can also be useful to treat the over-ground parts of the plant such as trunks, stems or stalks, leaves, flowers and fruit of the concerned plant.

Among the plants that can be protected by the method according to the invention, mention can be made of cotton; flax; vine; fruit or vegetable crops such as *Rosaceae* sp. (for instance pip fruit such as apples and pears, but also stone fruit such as apricots, almonds and peaches), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (for instance banana trees and plantains), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (for instance lemons oranges and grapefruit); *Solanaceae* sp. (for instance tomatoes), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (for instance lettuces), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (for instance peas), *Rosaceae* sp. (for instance strawberries); major crops such as *Graminae* sp. (for instance maize, lawn or cereals such as wheat, rice, barley and triticale), *Asteraceae* sp. (for instance sunflower), *Cruciferae* sp. (for instance colza), *Fabaceae* sp. (for instance peanuts), *Papilionaceae* sp. (for instance soybean), *Solanaceae* sp. (for instance potatoes), *Chenopodiaceae* sp. (for instance beetroots); horticultural and forest crops; as well as genetically modified homologues of these crops.

The method of treatment according to the invention can be used in the treatment of genetically modified organisms (GMOs), e.g. plants or seeds. Genetically modified plants (or transgenic plants) are plants in which a heterologous gene has been stably integrated into the genome. The expression "heterologous gene" essentially means a gene which is provided or assembled outside the plant and when introduced in the nuclear, chloroplastic or mitochondrial genome gives the transformed plant new or improved agronomic or other properties by expressing a protein or polypeptide of interest or by downregulating or silencing other gene(s)

which are present in the plant (using for example, antisense technology, co suppression technology or RNA interference – RNAi - technology). A heterologous gene that is located in the genome is also called a transgene. A transgene that is defined by its particular location in the plant genome is called a transformation or transgenic event.

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

15

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

30

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

35

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

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

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

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

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

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

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

Further herbicide-tolerant plants are also plants that are made tolerant to the herbicides inhibiting the enzyme hydroxyphenylpyruvatedioxygenase (HPPD). Hydroxyphenylpyruvatedioxygenases are enzymes that catalyze the reaction in which para-hydroxyphenylpyruvate (HPP) is transformed into homogentisate. Plants tolerant to HPPD-inhibitors can be transformed with a gene encoding a naturally-occurring resistant HPPD enzyme, or a gene encoding a mutated HPPD enzyme as described in WO 1996/038567, WO 1999/024585 and WO 1999/024586. Tolerance to HPPD-inhibitors can also be obtained by transforming plants with genes encoding certain enzymes enabling the formation of homogentisate despite the inhibition of the native HPPD enzyme by the HPPD-inhibitor. Such plants and genes are described in WO 1999/034008 and WO 2002/36787. Tolerance of plants to HPPD inhibitors can also be improved by

transforming plants with a gene encoding an enzyme prephenate dehydrogenase in addition to a gene encoding an HPPD-tolerant enzyme, as described in WO 2004/024928.

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

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

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

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

1) an insecticidal crystal protein from *Bacillus thuringiensis* or an insecticidal portion thereof, such as the insecticidal crystal proteins listed by Crickmore et al., Microbiology and Molecular Biology Reviews (1998), 62, 807-813, updated by Crickmore et al. (2005) at the *Bacillus thuringiensis* toxin nomenclature, online at:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), or insecticidal portions thereof, e.g., proteins of the Cry protein classes Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, or Cry3Bb or insecticidal portions thereof; or

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

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

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

5) an insecticidal secreted protein from *Bacillus thuringiensis* or *Bacillus cereus*, or an insecticidal portion thereof, such as the vegetative insecticidal (VIP) proteins listed at:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, e.g., proteins from the VIP3Aa protein class; or

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

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

8) a protein of any one of 1) to 3) above wherein some, particularly 1 to 10, amino acids have been replaced by another amino acid to obtain a higher insecticidal activity to a target insect species, and/or to expand the range of target insect species affected, and/or because of changes introduced into the encoding DNA during cloning or transformation (while still encoding an insecticidal protein), such as the VIP3Aa protein in cotton event COT102.

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

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

- a. plants which contain a transgene capable of reducing the expression and/or the activity of poly(ADP-ribose)polymerase (PARP) gene in the plant cells or plants as described in WO 2000/004173 or WO2006/045633 or PCT/EP07/004142.
- b. plants which contain a stress tolerance enhancing transgene capable of reducing the expression and/or the activity of the PARP encoding genes of the plants or plants cells, as described e.g. in WO 2004/090140.
- c. plants which contain a stress tolerance enhancing transgene coding for a plant-functional enzyme of the nicotinamide adenine dinucleotide salvage synthesis pathway including nicotinamidase, nicotinate phosphoribosyltransferase, nicotinic acid mononucleotide adenyl transferase, nicotinamide adenine dinucleotide synthetase or nicotine amide phosphoribosyltransferase as described e.g. in WO2006/032469 or WO 2006/133827 or PCT/EP07/002433.

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

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

2) transgenic plants which synthesize non starch carbohydrate polymers or which synthesize non starch carbohydrate polymers with altered properties in comparison to wild type plants without genetic modification. Examples are plants producing polyfructose, especially of the inulin and levan-type, as disclosed in EP 0663956, WO 1996/001904, WO 1996/021023, WO 1998/039460, and WO 1999/024593, plants producing alpha 1,4 glucans as disclosed in WO 1995/031553, US 2002/031826, US 6,284,479, US 5,712,107, WO 1997/047806, WO 1997/047807, WO 1997/047808 and WO 2000/014249, plants producing alpha-1,6 branched alpha-1,4-glucans, as disclosed in WO 2000/73422, plants producing alternan, as disclosed in WO 2000/047727, EP 06077301.7, US 5,908,975 and EP 0728213,

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

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

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

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

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

- b) Plants such as oilseed rape plants, producing oil having a low linolenic acid content as described in US 6,270,828, US 6,169,190 or US 5,965,755
- c) Plant such as oilseed rape plants, producing oil having a low level of saturated fatty acids as described e.g. in US 5,434,283

5

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

10

15

20

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

25

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

30

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

Powdery mildew diseases such as :

35

- Blumeria diseases, caused for example by *Blumeria graminis* ;
- Podosphaera diseases, caused for example by *Podosphaera leucotricha* ;
- Sphaerotheca diseases, caused for example by *Sphaerotheca fuliginea* ;
- Uncinula diseases, caused for example by *Uncinula necator* ;

Rust diseases such as :

Gymnosporangium diseases, caused for example by *Gymnosporangium sabinae* ;
Hemileia diseases, caused for example by *Hemileia vastatrix* ;
Phakopsora diseases, caused for example by *Phakopsora pachyrhizi* or *Phakopsora meibomia* ;
Puccinia diseases, caused for example by *Puccinia recondita* ;
5 Uromyces diseases, caused for example by *Uromyces appendiculatus* ;

Oomycete diseases such as :

Bremia diseases, caused for example by *Bremia lactucae* ;
Peronospora diseases, caused for example by *Peronospora pisi* or *P. brassicae* ;
Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora infestans* ;
10 Plasmopara diseases, caused for example by *Plasmopara viticola* ;
Pseudoperonospora diseases, caused for example by *Pseudoperonospora humuli* or

Pseudoperonospora cubensis ;

Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum* ;

Leafspot, leaf blotch and leaf blight diseases such as :

15 Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria solani* ;
Cercospora diseases, caused for example by *Cercospora beticola* ;
Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium cucumerinum* ;
Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus* ;
Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum* ;
20 Cycloconium diseases, caused for example by *Cycloconium oleaginum* ;
Diaporthe diseases, caused for example by *Diaporthe citri* ;
Elsinoe diseases, caused for example by *Elsinoe fawcettii* ;
Gloeosporium diseases, caused for example by *Gloeosporium laeticolor* ;
Glomerella diseases, caused for example by *Glomerella cingulata* ;
25 Guignardia diseases, caused for example by *Guignardia bidwelli* ;
Leptosphaeria diseases, caused for example by *Leptosphaeria maculans* ; *Leptosphaeria nodorum* ;
Magnaporthe diseases, caused for example by *Magnaporthe grisea* ;
Mycosphaerella diseases, caused for example by *Mycosphaerella graminicola* ; *Mycosphaerella*
arachidicola ; *Mycosphaerella fijiensis* ;
30 Phaeosphaeria diseases, caused for example by *Phaeosphaeria nodorum* ;
Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora teres* ;
Ramularia diseases, caused for example by *Ramularia collo-cygni* ;
Rhynchosporium diseases, caused for example by *Rhynchosporium secalis* ;
Septoria diseases, caused for example by *Septoria apii* or *Septoria lycopersici* ;
35 Typhula diseases, caused for example by *Typhula incarnata* ;
Venturia diseases, caused for example by *Venturia inaequalis* ;

Root and stem diseases such as :

Corticium diseases, caused for example by *Corticium graminearum* ;

Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium oxysporum* ;
 Gaeumannomyces diseases, caused for example by *Gaeumannomyces graminis* ;
 Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani* ;
 Tapesia diseases, caused for example by *Tapesia acuformis* ;
 5 Thielaviopsis diseases, caused for example by *Thielaviopsis basicola* ;

Ear and panicle diseases such as :

Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria spp.* ;
 Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus* ;
 Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium spp.* ;
 10 Claviceps diseases, caused for example by *Claviceps purpurea* ;
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum* ;
 Gibberella diseases, caused for example by *Gibberella zeae* ;
 Monographella diseases, caused for example by *Monographella nivalis* ;

Smut and bunt diseases such as :

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

Fruit rot and mould diseases such as :

20 Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus* ;
 Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea* ;
 Penicillium diseases, caused for example by *Penicillium expansum* ;
 Sclerotinia diseases, caused for example by *Sclerotinia sclerotiorum* ;
 Verticillium diseases, caused for example by *Verticillium alboatrum* ;

25 Seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off diseases :

Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria brassicicola*
 Aphanomyces diseases, caused for example by *Aphanomyces euteiches*
 Ascochyta diseases, caused for example by *Ascochyta lentis*
 Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus*
 30 Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium herbarum*
 Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus*
 (Conidiaform: *Drechslera*, *Bipolaris* Syn: *Helminthosporium*);
 Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum coccodes*;
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum*;
 35 Gibberella diseases, caused for example by *Gibberella zeae*;
 Macrophomina diseases, caused for example by *Macrophomina phaseolina*
 Monographella diseases, caused for example by *Monographella nivalis*;
 Penicillium diseases, caused for example by *Penicillium expansum*

Phoma diseases, caused for example by *Phoma lingam*
Phomopsis diseases, caused for example by *Phomopsis sojae*;
Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora cactorum*;
Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora graminea*
5 Pyricularia diseases, caused for example by *Pyricularia oryzae*;
Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum*;
Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*;
Rhizopus diseases, caused for example by *Rhizopus oryzae*
Sclerotium diseases, caused for example by *Sclerotium rolfsii*;
10 Septoria diseases, caused for example by *Septoria nodorum*;
Typhula diseases, caused for example by *Typhula incarnata*;
Verticillium diseases, caused for example by *Verticillium dahliae* ;

Canker, broom and dieback diseases such as :

Nectria diseases, caused for example by *Nectria galligena* ;

15 Blight diseases such as :

Monilinia diseases, caused for example by *Monilinia laxa* ;

Leaf blister or leaf curl diseases such as :

Taphrina diseases, caused for example by *Taphrina deformans* ;

Decline diseases of wooden plants such as :

20 Esca diseases, caused for example by *Phaemoniella clamydospora* ;

Eutypa dyebark, caused for example by *Eutypa lata* ;

Dutch elm disease, caused for example by *Ceratocystis ulmi* ;

Diseases of flowers and Seeds such as :

Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea* ;

25 Diseases of tubers such as :

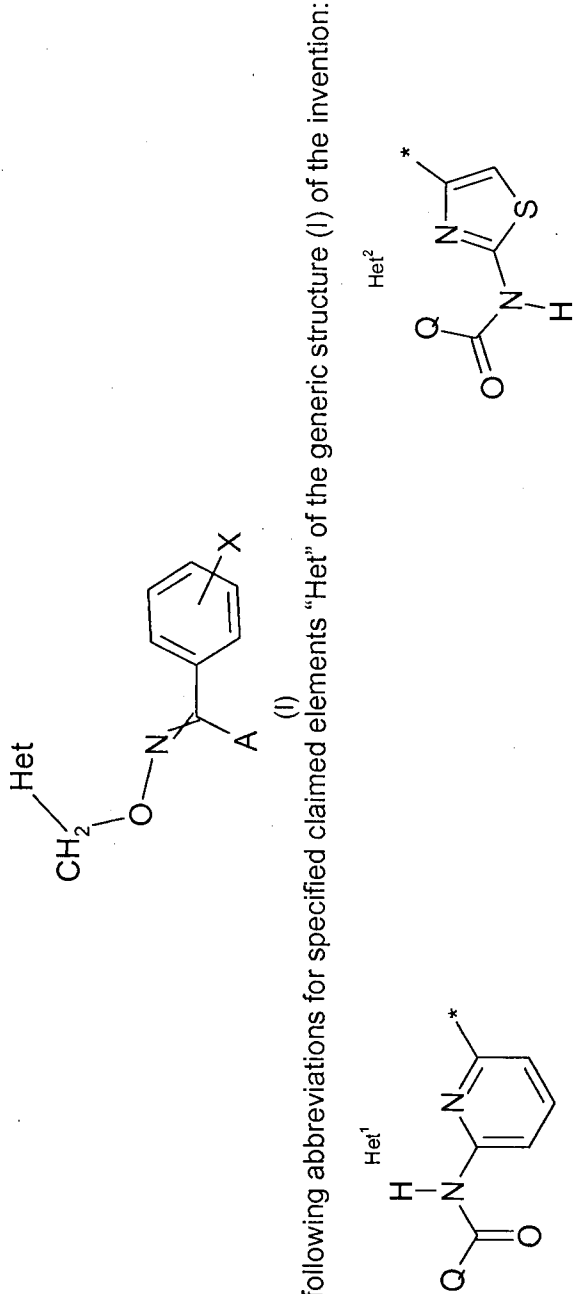
Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*

Helminthosporium diseases, caused for example by *Helminthosporium solani*.

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

35
The various aspects of the invention will now be illustrated with reference to the following
table 1 of compound examples and the following preparation or efficacy examples.

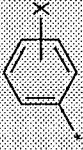
The following table 1 illustrates in a non limiting manner examples of compounds according to the invention.



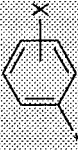
In table 1 we use the following abbreviations for specified claimed elements "Het" of the generic structure (I) of the invention:

Table 1

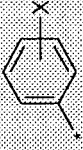
Ex.	A	Het	Q	MW_measured	log p
1	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	4-ethoxyphenyl	458*	3,69
2	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl	500*	3,48
3	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	difluoro(phenoxy)methyl		3,94
4	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	difluoro(3-methylphenoxy)methyl		4,26
5	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	difluoro(4-methylphenoxy)methyl		4,26

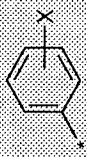
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
6	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het'	difluoro(phenylsulfonyl)methyl		4,11
7	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het'	difluoro[(4-methylphenyl)sulfonyl]methyl		4,44
8	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	2-cyclopentylethyl	452	4,26
9	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	2-cyclohexylethyl	466	4,65
10	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	2-phenoxyethyl	476	3,64
11	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	prop-2-en-1-yloxy	412	3,29
12	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	but-3-en-1-yloxy	426	3,58
13	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	but-3-yn-1-yloxy	424	3,21
14	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het'	but-2-yn-1-yloxy	424	3,37
15	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het'	but-3-yn-1-yloxy	412	2,88
16	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het'	prop-2-yn-1-yloxy	398	2,75
17	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	but-3-yn-1-yloxy	406	3,15
18	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	but-2-yn-1-yloxy	406	3,29
19	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	but-3-en-1-yloxy	408	3,55
20	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-chlorobutoxy	444	3,73
21	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	cycloheptyloxy	450	4,71

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
22	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-(benzyloxy)ethoxy	488	3,83
23	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	but-3-yn-1-yloxy	424	3,21
24	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	but-2-yn-1-yloxy	424	3,39
25	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-(benzyloxy)ethoxy	506	3,92
26	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-(benzyloxy)ethoxy	512	3,67
27	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	but-3-en-1-yloxy	426	3,67
28	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	prop-2-en-1-yloxy	412	3,37
29	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	prop-2-en-1-yloxy	418	3,13
30	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	4-chlorobutoxy	462	3,83
31	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-chlorobutoxy	468	3,55
32	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	cycloheptyloxy	468	4,78
33	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	cycloheptyloxy	474	4,39
34	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	pent-4-yn-1-yl	404	3,04
35	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	pent-4-yn-1-yl	422	3,15
36	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	pent-4-yn-1-yl	428	3,04
37	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	thiophen-2-ylmethyl	434	3,29

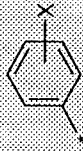
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
38	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	thiophen-2-ylmethyl	452	3,39
39	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	thiophen-2-ylmethyl	458	3,23
40	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	cyclohexylmethyl	434	4,12
41	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	cyclohexylmethyl	452	4,23
42	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-cyclohexylethyl	448	4,62
43	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-cyclohexylethyl	466	4,7
44	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-cyclopentylethyl	434	4,25
45	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-cyclopentylethyl	452	4,33
46	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	phenoxymethyl	444	3,58
47	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	phenoxymethyl	462	3,67
48	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	difluoro(phenylsulfanyl)methyl	496	4,2
49	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-(5-chlorothiophen-2-yl)ethyl	482	3,99
50	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	tetrahydro-2H-pyran-2-yl	422	3,46
51	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-cyclopentylethyl	434	4,11
52	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-cyclohexylethyl	448	4,51
53	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-phenoxyethyl	458	3,78

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
54	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-(2,2-dichloroethenyl)-2,2-dimethylcyclopropyl	501	4,62
55	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	pent-4-yn-1-yl	404	2,98
56	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	prop-2-en-1-yloxy	394	3,21
57	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	but-3-en-1-yloxy	408	3,51
58	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	but-2-yn-1-yloxy	406	3,25
59	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	prop-2-yn-1-yloxy	392	2,9
60	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-propylphenyl	456	4,39
61	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-phenylcyclopropyl	454	3,85
62	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	bicyclo[2.2.1]hept-2-ylmethyl	446	4,16
63	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-cyclohexylpropyl	462	4,94
64	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	phenoxymethyl	444	3,53
65	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	cyclohexylmethyl	434	4,04
66	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-(benzyloxy)ethoxy	488	3,76
67	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-chlorobutoxy	444	3,67
68	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-fluoroethoxy	400	2,78
69	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	4-propylphenyl		4,36

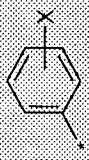
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
70	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	1-phenylcyclopropyl	460	3,94
71	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	2-phenylcyclopropyl		3,78
72	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	2-(5-chlorothiophen-2-yl)ethyl	488	3,83
73	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	tetrahydro-2H-pyran-4-yl		2,49
74	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	3-chlorophenyl	454	3,76
75	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	1-phenoxyethyl	464	3,53
76	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	3-fluorophenyl	438	3,42
77	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahydro-2,5-methanopentalen-3a(1H)-yl]bicyclo[2.2.1]hept-5-en-2-yl		4,21
78	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	bicyclo[2.2.1]hept-5-en-2-yl		3,39
79	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	pentadecafluoroheptyl		5,17
80	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	4-ethylphenyl		3,96
81	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	6-chloropyridin-3-yl		3,13
82	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	thiophen-2-yl	426	3,19
83	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	cyclohex-3-en-1-yl		3,42
84	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	cyclopropylmethyl		2,9
85	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	undecafluorocyclohexyl	624	4,44

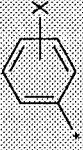
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
86	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	{[(1R,2S,5R)-5-methyl-2-(propan-2-yl)cyclohexyl]oxy)methyl		5,48
87	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	3-(2,2-dichloroethenyl)-2,2-dimethylcyclopropyl		4,49
88	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	2-methylbicyclo[2.2.1]hept-2-yl		4,19
89	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	difluoro[(4-methylphenyl)sulfanyl]methyl		4,21
90	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	difluoro(3-methylphenoxy)methyl	500	4,04
91	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	difluoro(4-methylphenoxy)methyl		4,09
92	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	4-ethoxyphenyl		3,71
93	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl		4,77
94	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	(1S,3R,5R,7S)-tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	492	4,73
95	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	methoxy(phenyl)methyl		
96	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	bicyclo[2.2.1]hept-2-ylmethyl	452	4,01
97	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl		3,37
98	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	(2-chlorophenoxy)methyl	484	3,62
99	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	4-butoxyphenyl		4,51
100	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	(1,1,1-trichloro-2-methylpropan-2-yl)oxy	518	4,39
101	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	4-(acetyloxy)butoxy		3,04

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
102	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	(1,7,7-trimethylbicyclo[2.2.1]hept-2-yl)oxy	496	4,97
103	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	(2-methylprop-2-en-1-yl)oxy		3,33
104	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	prop-1-en-2-yloxy	400	2,96
105	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	2,2,2-trichloroethoxy	490	3,71
106	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	morpholin-4-yl	423	2,17
107	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	prop-1-en-2-yloxy	394	3,21
108	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2,2,2-trichloroethoxy	484	4,06
109	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	piperidin-1-yl	421	2,69
110	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	1-phenylcyclopropyl	454	2,55
111	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-phenylethenyl	440	3,78
112	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-phenylcyclopropyl	454	3,94
113	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-(5-chlorothiophen-2-yl)ethyl	482	4,06
114	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	3-chlorophenyl	448	3,92
115	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	1-phenoxyethyl	458	3,85
116	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	3-fluorophenyl	432	3,48
117	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahydro-2,5-methanopentalen-3a(1H)-yl]	458	4,29

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
118	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	bicyclo[2.2.1]hept-5-en-2-yl	430	3,55
119	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	pentadecafluoroheptyl	706	5,93
120	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-ethylphenyl	442	4,01
121	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	6-chloropyridin-3-yl	449	3,15
122	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	thiophen-2-yl	420	3,29
123	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	cyclohex-3-en-1-yl	418	3,58
124	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	cyclopropylmethyl	392	2,94
125	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	undecafluorocyclohexyl	618	4,94
126	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	{[(1R,2S,5R)-5-methyl-2-(propan-2-yl)cyclohexyl]oxy}methyl	506	5,95
127	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	3-(2,2-dichloroethenyl)-2,2-dimethylcyclopropyl	500	4,73
128	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	difluoro[(4-methylphenyl)sulfonyl]methyl	510	4,49
129	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	difluoro(3-methylphenoxy)methyl	494	4,31
130	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	5-oxotetrahydrofuran-2-yl	422	2,44
131	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	difluoro(4-methylphenoxy)methyl	494	4,31
132	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-ethoxyphenyl	458	3,78
133	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	486	5

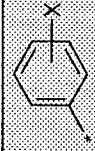
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
134	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	(1S,3R,5R,7S)-tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	486	5
135	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	bicyclo[2.2.1]hept-2-ylmethyl	446	4,26
136	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl	500	3,53
137	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	(2-methoxyethoxy)methyl	426	2,69
138	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-fluoro-2-(trifluoromethyl)phenyl	500	4,01
139	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	tetrahydro-2H-pyran-2-yl	422	3,48
140	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	(2-chlorophenoxy)methyl	478	3,92
141	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	[2-(2-methoxyethoxy)ethoxy]methyl	470	2,59
142	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	3-ethoxy-3-oxopropyl	438	2,92
143	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-butylphenyl	470	4,84
144	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	(benzyloxy)methyl	458	3,73
145	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	5-methoxy-5-oxopentyl	452	2,86
146	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	(3-chlorophenoxy)methyl	478	3,89
147	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-propylphenyl	456	4,49
148	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	4-ethoxy-4-oxobutyl	452	2,98
149	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het'	(4-chlorophenoxy)methyl	478	3,96

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
150	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	1,2,2,2-tetrafluoro-1-(heptafluoropropoxy)ethyl (benzylsulfanyl)methyl	622	4,92
151	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹		474	3,73
152	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	3-(4-chloro-2-methylphenoxy)propyl	520	4,62
153	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	3-phenoxypropyl	472	3,78
154	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-propylphenyl	480	4,41
155	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	1-phenylcyclopropyl	478	4,01
156	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(E)-2-phenylethenyl	464	3,69
157	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-phenylcyclopropyl	478	3,85
158	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-(5-chlorothiophen-2-yl)ethyl	506	3,94
159	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-chlorophenyl	472	3,87
160	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-fluorophenyl	456	3,53
161	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	tridecafluorohexyl	680	4,81
162	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahydro-2,5-methanopentalen-3a(1H)-yl]bicyclo[2.2.1]hept-5-en-2-yl	482	4,26
163	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²		454	3,48
164	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	pentadecafluoroheptyl	730**	5,17
165	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-fluoro-3-(trifluoromethyl)phenyl	524	3,89

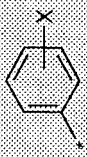
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
166	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-ethylphenyl	466	4,04
167	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	6-chloropyridin-3-yl	473	3,23
168	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	thiophen-2-yl	444	3,27
169	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	cyclohex-3-en-1-yl	442	3,48
170	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	cyclopropylmethyl	416	2,98
171	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	undecafluorocyclohexyl	642	4,51
172	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	{[(1R,2S,5R)-5-methyl-2-(propan-2-yl)cyclohexyl]oxy)methyl	530	5,47
173	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-dodecafluorohexyl	662	4,24
174	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-(2,2-dichloroethenyl)-2,2-dimethylcyclopropyl	524	4,7
175	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	difluoro[(4-methylphenyl)sulfanyl]methyl	534	4,26
176	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	difluoro(3-methylphenoxy)methyl	518**	4,14
177	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2,2-dichloro-1-ethyl-3-methylcyclopropyl	512	4,14
178	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	difluoro(4-methylphenoxy)methyl	518	4,19
179	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-ethoxyphenyl	482**	3,8
180	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	510**	4,84
181	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(1S,3R,5R,7S)-tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	510	4,84

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
182	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	bicyclo[2.2.1]hept-2-ylmethyl	470**	4,16
183	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(2-methoxyethoxy)methyl	450	2,68
184	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-fluoro-2-(trifluoromethyl)phenyl	524	3,92
185	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	tetrahydro-2H-pyran-2-yl	446	3,27
186	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	[2-(2-methoxyethoxy)ethoxy]methyl	494	2,66
187	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	prop-2-en-1-yl	402	2,84
188	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-ethoxy-3-oxopropyl	462	2,9
189	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(3-chlorophenoxy)methyl	502	3,8
190	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-ethoxy-4-oxobutyl	476**	3,04
191	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(4-chlorophenoxy)methyl	502**	3,82
192	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	heptafluoropropyl	530**	3,75
193	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	1,2,2,2-tetrafluoro-1-(heptafluoropropoxy)ethyl	646**	4,54
194	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(benzylsulfanyl)methyl	498	3,68
195	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-(4-chloro-2-methylphenoxy)propyl	544**	4,46
196	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-phenoxypropyl	496**	3,7
197	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(1,1,1-trichloro-2-methylpropan-2-yl)oxy	536**	4,51

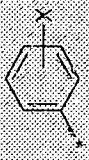
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
198	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-(acetyloxy)butoxy	492**	3,15
199	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	(1,7,7-trimethylbicyclo[2.2.1]hept-2-yl)oxy	514**	5,05
200	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	but-3-en-1-yloxy	432	3,37
201	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2,2,2-trichloroethoxy	508	3,85
202	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-(benzyloxy)ethoxy		3,53
203	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	pent-4-yn-1-yloxy	410	2,9
204	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	thiophen-2-ylmethyl	440	3,09
205	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	cyclohexylmethyl	440	3,89
206	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-cyclohexylethyl	454	4,3
207	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-cyclopentylethyl	440	3,99
208	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	phenoxymethyl	450	3,31
209	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	thiophen-2-ylmethyl	434	3,23
210	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	difluoro(phenylsulfanyl)methyl		3,85
211	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-cyclohexylpropyl	468	4,73
212	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-chlorophenyl	448	3,85
213	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-fluorophenyl	432	3,48

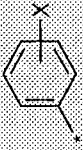
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
214	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	thiophen-2-yl	420	3,21
215	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-butylphenyl	470	4,78
216	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-ethylphenyl	442	3,99
217	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-phenoxypropyl	472	3,69
218	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	(benzylsulfanyl)methyl	474	3,73
219	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	5-(acetyl/sulfanyl)pentyl	482	3,55
220	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-(tetrahydrofuran-2-yl)ethyl	436	2,77
221	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-(thiophen-3-yl)propyl	462	3,7
222	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	thiophen-2-ylmethyl	440	3,13
223	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	cyclohexylmethyl	440	3,96
224	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	2-cyclohexylethyl	454	4,41
225	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	2-cyclopentylethyl	440	4,06
226	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	phenoxyethyl	450	3,37
227	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	difluoro(phenylsulfanyl)methyl	502	3,89
228	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	difluoro(phenoxy)methyl	486	3,78
229	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ²	3-cyclohexylpropyl	468	4,82

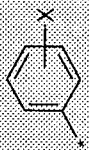
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
230	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	2-(benzyloxy)ethoxy	494	3,58
231	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	phenylethynyl	462	3,71
232	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	(Z)-2-chloro-2-phenylethenyl	498	3,89
233	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	thiophen-3-ylmethyl	458	3,21
234	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	pent-4-yn-1-yl	428	3,02
235	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	cyclohexylmethyl	458	4,01
236	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	2-cyclohexylethyl	472	4,44
237	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	2-cyclopentylethyl	458	4,11
238	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	phenoxymethyl	468	3,42
239	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	difluoro(phenylsulfonyl)methyl	520	3,94
240	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	difluoro(phenoxy)methyl	504	3,83
241	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	He ²	3-cyclohexylpropyl	486	4,84
242	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ¹	1-(4-bromophenoxy)ethyl	536	4,21
243	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	3-(2,2-dichloroethenyl)-2,2-dimethylcyclopropyl	506	4,44
244	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	(1,1,1-trichloro-2-methylpropan-2-yl)oxy	518	4,36
245	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	2,2,2-trichloroethoxy	490	3,7

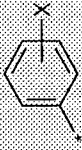
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
246	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	(2,4-dichlorophenoxy)methyl	518	4,06
247	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	(2-chlorophenoxy)methyl	484	3,61
248	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-chlorophenyl	454	3,73
249	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	(3-chlorophenoxy)methyl	484	3,7
250	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	(4-chlorophenoxy)methyl	484	3,68
251	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	6-chloropyridin-3-yl	455	3,09
252	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-(5-chlorothiophen-2-yl)ethyl	488	3,82
253	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	pentadecafluoroheptyl	712	5,08
254	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	1,2,2,2-tetrafluoro-1-(heptafluoropropoxy)ethyl	628	4,46
255	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-fluoro-2-(trifluoromethyl)phenyl	506	3,78
256	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl	506	3,33
257	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	difluoro(3-methylphenoxy)methyl	500	4,04
258	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	difluoro(4-methylphenoxy)methyl	500	4,06
259	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	difluoro[(4-methylphenyl)sulfanyl]methyl	516	4,16
260	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	undecafluorocyclohexyl	624	4,44
261	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-fluorophenyl	438	3,39

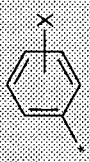
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
262	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	1-(4-fluorophenoxy)ethyl	476	3,79
263	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	(4-iodophenoxy)methyl	576	3,94
264	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	but-3-yn-1-yloxy	406	3,09
265	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	prop-2-en-1-yloxy	394	3,27
266	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahydro-2,5-methanopentalen-3a(1H)-yl]	464	4,14
267	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	1-phenylcyclopropyl	460	3,87
268	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-butylphenyl	476	4,68
269	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-propylphenyl	462	4,29
270	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-ethylphenyl	448	3,92
271	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-ethoxyphenyl	464	3,64
272	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	thiophen-2-yl	426	3,13
273	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	bicyclo[2.2.1]hept-5-en-2-yl	436	3,33
274	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-phenylcyclopropyl	460	3,71
275	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	cyclohex-3-en-1-yl	424	3,35
276	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	5-oxotetrahydrofuran-2-yl	428	2,26
277	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	1-phenoxyethyl	464	3,53

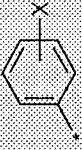
Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
278	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	(1S,3R,5R,7S)-tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	492	4,69
279	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	tricyclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ylmethyl	492	4,69
280	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	bicyclo[2.2.1]hept-2-ylmethyl	452	4,01
281	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	cyclopropylmethyl	398	2,84
282	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	3-ethoxy-3-oxopropyl	444	2,73
283	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	4-ethoxy-4-oxobutyl	458	2,9
284	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	{[(1R,2S,5R)-5-methyl-2-(propan-2-yl)cyclohexyl]oxy}methyl	512	5,39
285	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	[2-(2-methoxyethoxy)ethoxy]methyl	476	2,51
286	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	(2-methoxyethoxy)methyl	432	2,54
287	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	(1,7,7-trimethylbicyclo[2.2.1]hept-2-yl)oxy	496	4,92
288	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	4-(acetyloxy)butoxy	474	3
289	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	(biphenyl-2-yloxy)methyl	526	4,32
290	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	He ²	but-2-yn-1-yloxy	412	3,04
291	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	He ²	(benzyloxy)methyl	464	3,46
292	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	He ²	but-3-yn-1-yloxy	430	3,02

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
293	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	but-2-yn-1-yloxy	430	3,17
294	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-fluoroethoxy	424	2,77
295	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	3-fluorophenyl	Het ²	but-3-en-1-yloxy	432	3,39
296	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	1-methylcyclohexyl	458	4,16
297	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	4-butylphenyl	494	4,81
298	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	5-methoxy-5-oxopentyl	476	2,94
299	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-ethoxyethyl	434**	2,78
300	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	3-methoxybutoxy	464	3,13
301	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ²	2-methoxyethoxy	436	2,66
302	5-methyl-1H-tetrazol-1-yl	phenyl	Het ¹	2-fluoroethoxy	400	2,84
303	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-methylphenyl	Het ¹	2-cyclohexylethyl	462	4,73
304	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-methylphenyl	Het ¹	2-phenoxyethyl	472	3,67
305	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-chlorophenyl	Het ¹	2-cyclohexylethyl	482	4,7
306	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-methylphenyl	428	3,65
307	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-methylphenyl	428	3,5
308	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-fluorophenyl	432	3,46

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
309	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-fluorophenyl	431	3,52
310	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	4-chlorophenyl		3,83
311	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-chlorophenyl	448	3,44
312	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-methoxyphenyl	444	3,44
313	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	3-ethoxyphenyl	458	3,79
314	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	2-chloropyridin-3-yl		2,82
315	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-methylphenyl	Het ¹	but-3-en-1-yloxy	422	3,65
316	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-methylphenyl	Het ¹	but-3-yn-1-yloxy	420	3,23
317	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²		489	3,83
318	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-(trifluoromethyl)phenyl	488	3,92
319	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-phenoxyphenyl	512	4,36
320	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	quinolin-2-yl	471	4,04
321	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2,4-difluorophenyl	456	3,37
322	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-methoxyphenyl	450	3,5
323	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3,5-dichlorophenyl	488	4,36
324	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-iodophenyl	546	4,01

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
325	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-(trifluoromethoxy)phenyl	504	3,61
326	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-fluorophenyl	438	3,39
327	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-methylphenyl	434	3,41
328	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-(trifluoromethoxy)phenyl	516	3,9
329	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	4-fluorophenyl	450	3,57
330	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	4-phenoxyphenyl	524	4,51
331	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-methylphenyl	446	3,61
332	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-chloropyridin-3-yl	455	2,73
333	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-chlorophenyl	454	3,74
334	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-chlorophenyl	454	3,29
335	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	4-methylphenyl	434	3,59
336	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2,4-dichlorophenyl	488	3,76
337	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-bromophenyl	498	3,33
338	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	2-fluorophenyl	438	3,27
339	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²		472	3,96
340	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3,5-difluorophenyl	456	3,63

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
341	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-fluoro-5-(trifluoromethyl)phenyl	506	4,11
342	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²		502	3,81
343	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²		518	4,16
344	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	3-bromophenyl		3,85
345	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-methoxyphenyl	462	3,79
346	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3,5-dichlorophenyl	500	4,61
347	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3-iodophenyl	558	4,21
348	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3-fluoro-5-(trifluoromethyl)phenyl	518	4,34
349	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3-propoxyphenyl	490	4,31
350	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3-methoxy-5-(trifluoromethyl)phenyl	530	4,59
351	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹		514	3,99
352	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹		530	4,31
353	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3-bromophenyl	510	4,06
354	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	2-chloro-4-methylphenyl	480	3,9
355	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹		501	4,06
356	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	3-(trifluoromethyl)phenyl	500	4,11

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
357	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	3-phenoxyphenyl	524	4,51
358	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	furan-2-yl	422	3,04
359	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	2,4-difluorophenyl	468	3,76
360	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	2-chloropyridin-3-yl	467	2,94
361	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	4-chlorophenyl	466	3,94
362	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	2-chlorophenyl	466	3,57
363	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	4-methylphenyl	446	3,76
364	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	2,4-dichlorophenyl	500	4,04
365	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	2-bromophenyl	510	3,59
366	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	2-fluorophenyl	450	3,65
367	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het		484	4,19
368	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	3,5-difluorophenyl	468	3,83
369	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	3-ethoxyphenyl	476	3,87
370	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het	3-methoxyphenyl	462	3,55
371	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-methylphenyl	Het	4-methylphenyl	442	3,81
372	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-chlorophenyl	Het	but-3-yn-1-yloxy	440	3,21

Ex.	A		Het	Q	MW_measured	log p
373	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	2-chlorophenyl	Het ¹	2-phenoxyethyl	492	3,63
374	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	3-fluorophenyl	Het ¹	but-3-yn-1-yloxy	424	3,21
375	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	difluoro(phenoxy)methyl	480	3,94
376	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	but-3-yn-1-yloxy	412	2,88
377	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ¹	but-3-yn-1-yloxy	406	3,09
378	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	phenoxyethyl	450	3,33
379	1-methyl-1H-tetrazol-5-yl	phenyl	Het ²	phenoxyethyl	450	3,13

Measurement of logP values was performed according EEC directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid

Chromatography) on reversed phase columns with the following methods:

measurement of LC-MS was done at pH 2.7 with 0,1 % formic acid in water and with acetonitrile (contains 0,1% formic acid) as eluent with a linear gradient from 10 % acetonitrile to 95 % acetonitrile.

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

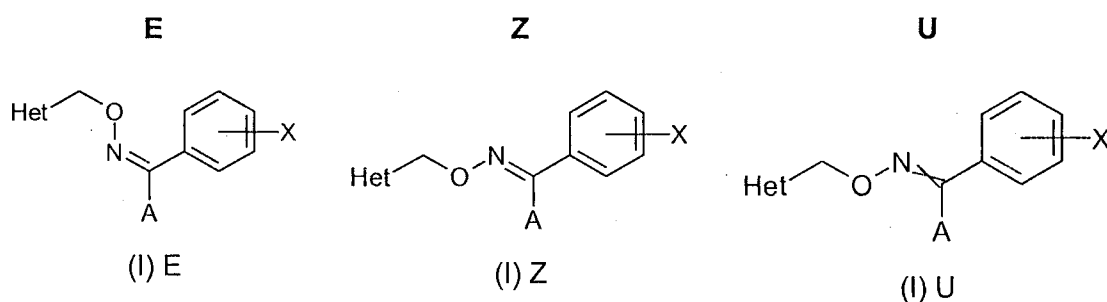
In table 1, M+H (or M H) means the molecular ion peak, plus or minus 1 a.m.u. (atomic mass unit) respectively, as observed in mass spectroscopy and M (Apcl+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy

Molecular Weight measurement, Method:

** LCT-ESI

SQD-ESI

In the following list we specify the double bond geometry of the examples of table 1 as shown here:



5 **Example (Double bond geometry) of the examples of table 1:**

- 1 (E), 2 (E), 3 (U), 4 (U), 5 (U), 6 (U), 7 (U), 8 (U), 9 (U), 10 (U), 11 (U), 12 (U), 13 (U), 14 (U),
 15 (U), 16 (U), 17 (U), 18 (U), 19 (U), 20 (U), 21 (U), 22 (U), 23 (U), 24 (U), 25 (U), 26 (U), 27
 10 (U), 28 (U), 29 (U), 30 (U), 31 (U), 32 (U), 33 (U), 34 (U), 35 (U), 36 (U), 37 (U), 38 (U), 39 (U),
 40 (U), 41 (U), 42 (U), 43 (U), 44 (U), 45 (U), 46 (U), 47 (U), 48 (U), 49 (Z), 50 (Z), 51 (Z), 52 (Z),
 53 (Z), 54 (Z), 55 (Z), 56 (Z), 57 (Z), 58 (Z), 59 (Z), 60 (Z), 61 (Z), 62 (Z), 63 (Z), 64 (Z), 65 (Z),
 66 (Z), 67 (Z), 68 (Z), 69 (U), 70 (U), 71 (U), 72 (U), 73 (U), 74 (U), 75 (U), 76 (U), 77 (U), 78 (U),
 79 (U), 80 (U), 81 (U), 82 (U), 83 (U), 84 (U), 85 (U), 86 (U), 87 (U), 88 (U), 89 (U), 90 (U), 91
 15 (U), 92 (U), 93 (U), 94 (U), 95 (U), 96 (U), 97 (U), 98 (U), 99 (U), 100 (U), 101 (U), 102 (U), 103
 (U), 104 (U), 105 (U), 106 (U), 107 (U), 108 (U), 109 (U), 110 (U), 111 (U), 112 (U), 113 (U), 114
 (U), 115 (U), 116 (U), 117 (U), 118 (U), 119 (U), 120 (U), 121 (U), 122 (U), 123 (U), 124 (U), 125
 (U), 126 (U), 127 (U), 128 (U), 129 (U), 130 (U), 131 (U), 132 (U), 133 (U), 134 (U), 135 (U), 136
 (U), 137 (U), 138 (U), 139 (U), 140 (U), 141 (U), 142 (U), 143 (U), 144 (U), 145 (U), 146 (U), 147
 (U), 148 (U), 149 (U), 150 (U), 151 (U), 152 (U), 153 (U), 154 (Z), 155 (Z), 156 (Z), 157 (Z), 158
 20 (Z), 159 (Z), 160 (Z), 161 (Z), 162 (Z), 163 (Z), 164 (Z), 165 (Z), 166 (Z), 167 (Z), 168 (Z), 169
 (Z), 170 (Z), 171 (Z), 172 (Z), 173 (Z), 174 (Z), 175 (Z), 176 (Z), 177 (Z), 178 (Z), 179 (Z), 180
 (Z), 181 (Z), 182 (Z), 183 (Z), 184 (Z), 185 (Z), 186 (Z), 187 (Z), 188 (Z), 189 (Z), 190 (Z), 191
 (Z), 192 (Z), 193 (Z), 194 (Z), 195 (Z), 196 (Z), 197 (Z), 198 (Z), 199 (Z), 200 (Z), 201 (Z), 202
 (Z), 203 (Z), 204 (Z), 205 (Z), 206 (Z), 207 (Z), 208 (U), 209 (Z), 210 (U), 211 (Z), 212 (Z), 213
 25 (Z), 214 (Z), 215 (Z), 216 (Z), 217 (Z), 218 (Z), 219 (U), 220 (U), 221 (U), 222 (U), 223 (U), 224
 (U), 225 (U), 226 (U), 227 (U), 228 (U), 229 (U), 230 (U), 231 (Z), 232 (Z), 233 (Z), 234 (Z), 235
 (Z), 236 (Z), 237 (Z), 238 (Z), 239 (Z), 240 (Z), 241 (Z), 242 (U), 243 (Z), 244 (Z), 245 (Z), 246
 (U), 247 (Z), 248 (Z), 249 (Z), 250 (Z), 251 (Z), 252 (Z), 253 (Z), 254 (Z), 255 (Z), 256 (Z), 257
 (Z), 258 (Z), 259 (Z), 260 (Z), 261 (Z), 262 (U), 263 (U), 264 (U), 265 (U), 266 (Z), 267 (Z), 268
 30 (Z), 269 (Z), 270 (Z), 271 (Z), 272 (Z), 273 (Z), 274 (Z), 275 (Z), 276 (Z), 277 (Z), 278 (Z), 279
 (Z), 280 (Z), 281 (Z), 282 (Z), 283 (Z), 284 (Z), 285 (Z), 286 (Z), 287 (Z), 288 (Z), 289 (U), 290
 (U), 291 (U), 292 (U), 293 (U), 294 (U), 295 (U), 296 (Z), 297 (Z), 298 (Z), 299 (Z), 300 (Z), 301
 (Z), 302 (U), 303 (U), 304 (U), 305 (U), 306 (Z), 307 (Z), 308 (Z), 309 (Z), 310 (Z), 311 (Z), 312
 (Z), 313 (Z), 314 (Z), 315 (U), 316 (U), 317 (Z), 318 (Z), 319 (Z), 320 (Z), 321 (Z), 322 (Z), 323
 35 (Z), 324 (Z), 325 (Z), 326 (Z), 327 (Z), 328 (Z), 329 (Z), 330 (Z), 331 (Z), 332 (Z), 333 (Z), 334
 (Z), 335 (Z), 336 (Z), 337 (Z), 338 (Z), 339 (Z), 340 (Z), 341 (Z), 342 (Z), 343 (Z), 344 (Z), 345
 (Z), 346 (Z), 347 (Z), 348 (Z), 349 (Z), 350 (Z), 351 (Z), 352 (Z), 353 (Z), 354 (Z), 355 (Z), 356
 (Z), 357 (Z), 358 (Z), 359 (Z), 360 (Z), 361 (Z), 362 (Z), 363 (Z), 364 (Z), 365 (Z), 366 (Z), 367
 (Z), 368 (Z), 369 (Z), 370 (Z), 371 (U), 372 (U), 373 (U), 374 (Z), 375 (Z), 376 (Z), 377 (Z), 378
 40 (Z), 379 (E),

Example A**Phytophthora test (tomato) / preventive**

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

5 Emulsifier: 1 part by weight of Alkylaryl polyglycoether

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

10

To test for preventive activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. One day after this treatment, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Phytophthora infestans*. The plants remain for one day in an incubation cabinet at approximately 22°C and a relative atmospheric humidity of 100%. Then the plants are placed in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 96%.

15

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

20

In this test the following examples of table 1 according to the invention showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 500ppm of active ingredient:

Examples Number 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 75, 76, 78, 80, 83, 84, 90, 91, 92, 93, 94, 96, 98, 99, 100, 102, 103, 104, 105, 106, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 129, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 146, 148, 149, 151, 160, 165, 175, 176, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 375, 376 and 377.

30

Example B**Plasmopara test (grapevines) / protective**

35

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

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

10 To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Plasmopara viticola* and then remain for 1 day in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 100 %. The plant is subsequently placed for 4 days in a greenhouse at approximately 21°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90 %. The plants are then misted and placed for 1 day in an incubation
15 cabinet.

The test is evaluated 6 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

20 In this test the following examples of table 1 according to the invention showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 10ppm of active ingredient:

Examples Number 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 17, 18, 19, 20, 23, 24, 27, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 67, 70, 71, 76, 80, 82, 84, 114, 115, 116, 135, 160, 202, 205, 206, 207, 208, 209, 212, 213, 214, 216, 218, 220, 221, 223, 226, 230, 233, 234, 237, 238, 376 and 377.

25

Example C

In vitro-Test for the calculation of the ED50-value with *Pythium aphanidermatum*

30 Wells of 96-hole microtitre plates are filled with 10µl of a solution of the test compound in methanol together with the emulsifier alkylaryl polyglycol ether. Thereafter, the solvent is evaporated in a hood. At the next step, into each well 200µl of liquid potato dextrose medium is given that has been amended with an appropriate concentration of spores or mycelium suspension of the test fungus. The resulting concentrations of the test compounds in the microlitre well are 50, 5, 0,5 and 0,05
35 ppm. The resulting concentration of the emulsifier in all wells is constantly 300 ppm.

With the aid of a photometer the extinction in all wells is measured at the wavelength of 620 nm.

The microtiter plates are then transferred for 3-5 days onto a shaker at 20°C and 85 % relative humidity.

5

At the end of the incubation time the growth of the test organisms is measured again photometrically at the wavelength of 620 nm. The difference between the two extinction values (taken before and after incubation) is proportional to the growth of the test organism.

10

Based on the Δ extinction data from the different test concentrations and that of the untreated test organism (control) a dose-response curve is calculated. The concentration that is necessary to give 50 % growth inhibition is defined and reported as ED50-value (= Effective Dose that causes 50 % growth inhibition) in ppm (= mg / l).

15

In this test the following examples of table 1 according to the invention showed an ED50-value lower than 1 ppm: Examples Number 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 28, 29, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 69, 71, 73, 77, 78, 80, 81, 82, 83, 84, 86, 87, 89, 91, 92, 93, 97, 99, 101, 103, 106, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 129, 130, 131, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 145, 146, 148, 149, 150, 151, 160, 164, 165, 171, 175, 176, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 221, 224, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 375, 376 and 377.

20

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

25

Preparation of N-{6-[{{{1-methyl-1H-tetrazol-5-yl}(phenyl)methylene}amino}oxy)methyl]pyridin-2-yl}hex-5-ynamide (Compound 34) according to process P2

30

Step 1: Preparation 2-{6-[{{{1-methyl-1H-tetrazol-5-yl}(phenyl)methylene}amino}oxy)methyl]pyridin-2-yl}-1H-isoindole-1,3(2H)-dione

35

To a solution of N-hydroxy-1-(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)-1-phenylmethanimine (21.5g, 0.106 mol) in acetonitrile (638 mL) was added cesium carbonate (72.4g, 0.222 mol), potassium

iodide (1.76g, 0.011mol) and then 2-[6-(bromomethyl)pyridin-2-yl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione (35.23g, 0.111 mol), the white slurry was stirred at room temperature for four hours at room temperature. Water (700 mL) was added, the precipitate was filtered off and washed with water until colourless, then dried in vacuo overnight to yield to of 2-[6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione [40.0 g ; 86%
5 of theory ; HPLC/MS : m/z = 440 (M+H) ; logP(HCOOH) = 3.04].

Step 2: Preparation of 6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-amine

10 To a solution of 2-[6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione (119g, 0.271 mol) in tetrahydrofuran (2610 mL) was added hydrazine hydrate (66.26mL, 1.354 mol), the reaction mixture was stirred at room temperature for six hours at room temperature. The precipitate which has formed was filtered off and washed with tetrahydrofuran, the filtrate was
15 then concentrated *in vacuo* to produce an off-white solide which was further purified by trituration in dichloromethane yielding to 6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-amine [83.0 g ; 94% of theory ; HPLC/MS : m/z = 310 (M+H) ; logP(HCOOH) = 1.14].

20 *Step 3: Preparation of N-{6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl}hex-5-ynamide*

To a solution of 6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-amine (251 mg, 0.81mmol) in dichloromethane (10mL) was added triethylamine (0.22 mL, 1.62 mmol) , hex-5-ynoyl chloride
25 (211 mg, 1.62 mmol). The reaction mixture was stirred for 5 hours at room temperature, concentrated *in vacuo*, and then purified by silica gel chromatography to yield to N-{6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl}hex-5-ynamide [200 mg; 95% of purity ; 58% of theory ; HPLC/MS : m/z = 404 (M+H) ; logP_(HCOOH) = 2.98].

30

Preparation of 4-chlorobutyl {6-[[[(Z)-(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl}carbamate (Compound 67) according to process P3

Step 1: Preparation of 2-(6-(((1,3-dioxo-1,3-dihydro-2H-isoindol-2-yl)oxy)methyl)pyridin-2-yl)-1H-isoindole-1,3(2H)-dione

A suspension of N-hydroxyphthalimide (35.0g, 214 mmol), 2-[6-(bromomethyl)pyridin-2-yl]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione (74.8 g, 236 mmol), cesium carbonate (146.8 g, 450 mmol) and potassium iodide (1.78g, 10.7 mmol) in acetonitrile (350 mL) was stirred at room temperature for 18h. Water (300 mL) was added, the precipitate was filtered off and washed with water until colourless, then dried in vacuo overnight to yield 2-(6-(((1,3-dioxo-1,3-dihydro-2H-isoindol-2-yl)oxy)methyl)pyridin-2-yl)-1H-isoindole-1,3(2H)-dione as a colourless solid [85.0 g ; 94% of theory ; HPLC/MS : m/z = 400 (M+H) ; logP(HCOOH) = 2.44].

Step 2: Preparation of 6-[(aminooxy)methyl]pyridin-2-amine

To a solution of 2-(6-(((1,3-dioxo-1,3-dihydro-2H-isoindol-2-yl)oxy)methyl)pyridin-2-yl)-1H-isoindole-1,3(2H)-dione (50g, 125 mmol) in THF (350 mL) was added dropwise hydrazine hydrate (61 mL, 1.25 mol) at room temperature. After stirring overnight at room temperature, the reaction mixture was filtered and the filtrate was concentrated to dryness *in vacuo*. Purification of the residue on silica gel afforded 6-[(aminooxy)methyl]pyridin-2-amine as a colourless oil [10.0 g ; 57% of theory ; HPLC/MS : m/z = 140 (M+H) ; logP(HCOOH) < -0.23].

Step 3: Preparation of 6-((((1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene)amino)oxy)methyl]pyridin-2-amine by the condensation of 6-[(aminooxy)methyl]pyridin-2-amine with 1-(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)-1-phenylmethanimine

Under protective gas (argon), a reaction tube containing a solution of (1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methanone (188 mg; 1.0 mmol), 6-[(aminooxy)methyl]pyridin-2-amine (139 mg ; 1.0 mmol) and p-toluenesulfonic acid monohydrate (190 mg; 1.0 mmol) in 2-propanol (2 mL) is sealed and heated in a microwave oven at 160°C for 90 min. For workup, the mixture is allowed to cool down, diluted with dichloromethane (10 mL) and washed twice with 3 ml each time of sat. aq. sodium bicarbonate. The aqueous phase is extracted with dichloromethane and the combined organic layers dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure. Purification on silica gel affords 6-((((1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene)amino)oxy)methyl]pyridin-2-amine as a colourless oil [205 mg ; 66% of theory ; HPLC/MS : m/z = 310 (M+H) ; logP_(HCOOH) = 1.13].

Step 4: Preparation of 4-chlorobutyl {6-[[[(Z)-(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl}carbamate (Compound 67)

To a stirred solution of 6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)-
5 methyl]pyridin-2-amine (150 mg, 0.485 mmol) in dichloromethane (5 mL), was added pyridine
(0.078mL), 4-chlorobutyl carbonochloridate (166mg, 0.970mmol) .The reaction mixture was
stirred for 5 hours at room temperature, concentrated *in vacuo*, and then purified by silica gel
chromatography to yield to 4-chlorobutyl {6-[[[(Z)-(1-methyl-1H-tetrazol-5-
yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)methyl]pyridin-2-yl}carbamate [200 mg; 90% of purity ; 84% of
10 theory ; HPLC/MS : m/z = 344 (M+H) ; logP_(HCOOH) = 3.67].

Preparation of 4-[(aminooxy)methyl]-1,3-thiazol-2-amine

*Step 1: Preparation of 2-[(2-amino-1,3-thiazol-4-yl)methoxy]-1H-isoindole-1,3(2H)-
15 dione*

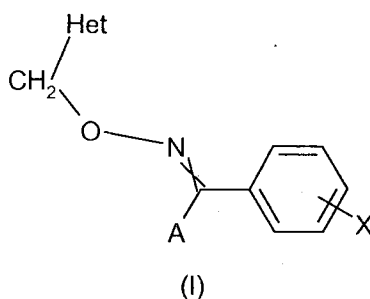
A suspension of N-hydroxyphthalimide (50.0g, 306 mmol), 4-(chloromethyl)-1,3-
thiazol-2-amine (50.1 g, 337 mmol), cesium carbonate (210 g, 0.64 mol) and potassium iodide
(2.54g, 15.3 mmol) in acetonitrile (440 mL) was stirred at room temperature for 18h. Water (300
mL) was added, the precipitate was filtered off and washed with water until colourless, then
20 dried in vacuo overnight to afford 2-[(2-amino-1,3-thiazol-4-yl)methoxy]-1H-isoindole-1,3(2H)-
dione as a colourless solid [36.0 g ; 43% of theory ; HPLC/MS : m/z = 276 (M+H) ;
logP_(HCOOH) = 0.74].

Step 2: 4-[(aminooxy)methyl]-2-bromo-1,3-thiazole

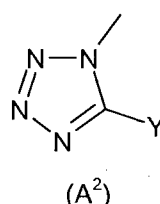
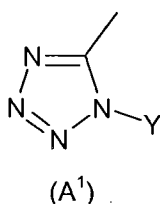
25 To a solution of 2-[(2-amino-1,3-thiazol-4-yl)methoxy]-1H-isoindole-1,3(2H)-dione
(10g, 36.3 mmol) in THF (100 mL) was added dropwise hydrazine hydrate (9.1 g, 181 mmol) at
room temperature. After stirring overnight at room temperature, the reaction mixture was filtered
and the filtrate was concentrated to dryness *in vacuo*. Purification of the residue on silica gel
afforded 4-[(aminooxy)methyl]-2-bromo-1,3-thiazole as a colourless oil [5.2 g ; 99% of theory ;
30 HPLC/MS : m/z = 146 (M+H) ; logP_(HCOOH) < -0.23].

CLAIMS

1. A compound of formula (I)

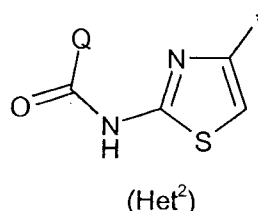
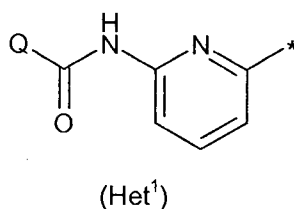


- X represents a hydrogen atom, a halogen atom, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, a cyano group, a methanesulfonyl group, a nitro group, a trifluoromethyl group or an aryl group ;
- A represents a tetrazoyl group of formula (A¹) or (A²):



wherein Y represents substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl; and

- Het represents a pyridyl group of formula (Het¹) or a thiazolyl group of formula (Het²) ;



wherein

- Q represents a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₃-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted aryl-cyclopropyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl-C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-

substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted benzyloxy, substituted or non-substituted phenoxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; [substituted aryl]-[C₁-C₈]-alkyl; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-halogenoalkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S and having 1 to 5 halogen atoms; substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)-silyloxy, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkenyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkyl-[C₁-C₈]-alkyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkenyl-[C₁-C₈]-alkyl, substituted or non-substituted arylcarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclylcarbonyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S;

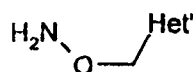
as well as salts, N-oxides, metallic complexes and metalloidic complexes thereof or (E) and (Z) isomers and mixtures thereof.

2. A compound according to claim 1 wherein X represents a hydrogen atom, a halogen atom, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, a cyano group, a methanesulfonyl group, a nitro group, a trifluoromethyl group or an aryl group.
3. A compound according to claim 2 wherein X represents a chlorine atom, a fluorine atom, a methyl group, an ethyl group, an n-propyl group, an isopropyl group, an n-butyl group, an isobutyl group, a sec-butyl group, a tert-butyl group, a methoxy group, an ethoxy group, a propoxy group, an isopropoxy group or a hydrogen atom.

4. A compound according to claims 1 to 3 wherein Y represents a methyl group, an ethyl group, an n-propyl group or an isopropyl group.
5. A compound according to claims 1 to 4 wherein Q represents a substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted benzyloxy, substituted or non-substituted phenoxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-halogenoalkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S and having 1 to 5 halogen atoms; substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkyl, substituted or non-substituted C₅-C₁₂-fused bicycloalkenyl.
6. A compound according to claim 5 wherein Q represents a substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted benzyloxy, substituted or non-substituted phenoxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S.

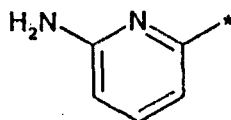
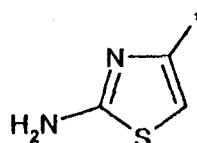
7. A compound according to claim 6 wherein Q represents a substituted or non-substituted C₃-C₈-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted phenoxyalkyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted aryl, substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S; substituted or non-substituted, saturated or unsaturated 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclyl-[C₁-C₈]-alkyl comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S.

8. A compound of formula (VI):



(VI)

- or one of its salts wherein Het' represents a pyridyl group of formula (Het' ¹) or a thiazolyl group of formula (Het' ²):

(Het' ¹)(Het' ²)

9. A fungicide composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of formula (I) according to claims 1 to 7 and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

10. A method for controlling phytopathogenic fungi of crops, characterized in that an agronomically effective and substantially non-phytotoxic quantity of a compound according to

WO 2010/000841

PCT/EP2009/058427

62

claims 1 to 7 or a composition according to claim 9 is applied to the soil where plants grow or are capable of growing, to the leaves and/or the fruit of plants or to the seeds of plants.

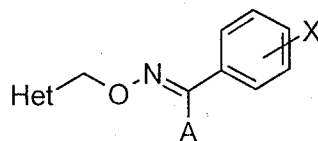
claims 1 to 7 or a composition according to claim 9 is applied to the soil where plants grow or are capable of growing, to the leaves and/or the fruit of plants or to the seeds of plants.

DERIVADOS DE HIDROXIMOIL-TETRAZOL FUNGICIDAS

DESCRIPCIÓN

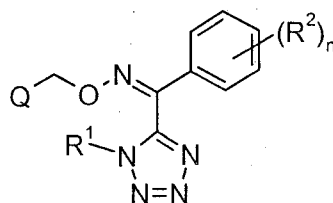
5 La presente invención se refiere a derivados de hidroximoil-tetrazol, a su procedimiento de preparación, a su uso como agentes activos fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas y a métodos para luchar contra hongos fitopatógenos, especialmente de plantas, usando estos compuestos o composiciones.

10 En la solicitud de patente Europea N° 1426371 se describen algunos derivados de tetrazoiloxima de la siguiente estructura química:



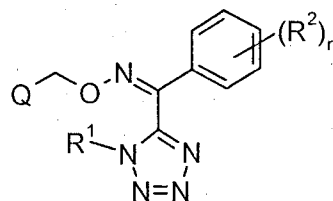
en la que A representa un grupo tetrazolilo, Het representa un grupo piridinilo particular o un grupo tiazolilo particular.

15 En la solicitud de patente japonesa N° 2004 -131392 se describen algunos derivados de tetrazoiloxima de la siguiente estructura química:



en la que Q puede seleccionarse de una lista de 15 grupos heterocíclicos distintos.

En la solicitud de patente japonesa N° 2004 -131416 se describen algunos derivados de tetrazoiloxima de la siguiente estructura química:



en donde Q se puede seleccionar entre un grupo piridinilo o un grupo tiazolilo.

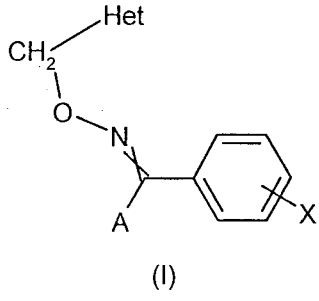
No se ha demostrado que los compuestos descritos en estos tres documentos proporcionen una utilidad comparable a la de los compuestos de acuerdo con la invención.

25

Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura, el uso de nuevos compuestos pesticidas con objeto de evitar el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos o luchar contra

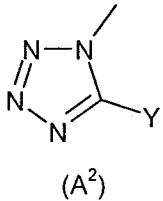
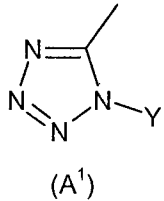
ellas. Es también de gran interés el uso de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con objeto de reducir las cantidades de compuesto activo que se han de utilizar, manteniendo al mismo tiempo una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos. Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o las ventajas mencionadas anteriormente.

De acuerdo con ello, la presente invención proporciona un derivado de tetrazoiloxima de fórmula (I)



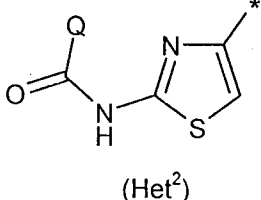
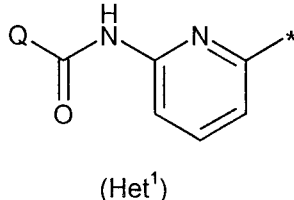
en la que

- X representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, un grupo ciano, un grupo metanosulfonilo, un grupo nitro, un grupo trifluorometilo o un grupo arilo ;
- A representa un grupo tetrazoilo de fórmula (A¹) o (A²):



en donde Y representa alquilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir; y

- Het representa un grupo piridilo de fórmula (Het¹) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het²) ;



en la que

- Q representa a tri(alquilo-C₁-C₈)sililo-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, tri(alquilo C₁-C₈)sililo-cicloalquilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, aril-ciclopropilo sustituido o sin sustituir, halogenocicloalquilo C₃-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquenilo-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, C₂-C₈-sustituido o sin sustituir , alquinilo-C₁-C₈

sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenoalcoxialquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alqueniloxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalqueniloxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquiniloxi-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, (alqueniloxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, (alquiniloxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, (benciloxiimino)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, benciloxi sustituido, fenoxi sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; [arilo sustituido]-alquilo-[C₁-C₈]; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-halogenoalquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S y que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; tri(alquilo-C₁-C₈)-sililoxi sustituido o sin sustituir, bicicloalquilo-C₅-C₁₂ condensado sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo-C₅-C₁₂ condensado sustituido o sin sustituir, bicicloalquilo-C₅-C₁₂ condensado-alquilo-[C₁-C₈] sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo-C₅-C₁₂ condensado-alquilo-[C₁-C₈] sustituido o sin sustituir, arilcarbonilo sustituido o sin sustituir, alquilo-C₁-C₈-carbonilo sustituido o sin sustituir, heterociclicarbonilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; así como sales, N-óxidos, complejos metálicos y complejos metaloides de los mismos o isómeros (E) y (Z) y mezclas de los mismos.

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

En particular, la estereoestructura del resto de oxima presente en el derivado de heterociclicloxima de fórmula (I) incluye los isómeros (E) o (Z), y estos estereoisómeros forman parte de la presente invención.

Conforme a la invención, generalmente se usan las siguientes expresiones genéricas, con los siguientes significados:

- halógeno se refiere a: flúor, cloro, bromo o yodo;
- heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre;
- 5 • a menos que se indique otra cosa, un grupo o un sustituyente que está sustituido de acuerdo con la invención puede estar sustituido con uno o más de los siguientes grupos o átomos: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfenilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfenilo, un grupo formilo, una carbaldehído
- 10 O-(alquilo-C₁-C₈)oxima sustituida o sin sustituir, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo formilamino, un grupo (hidroxiimino)-alquilo-C₁-C₆, un alquilo-C₁-C₈, un tri(alquilo-C₁-C₈)silyl-alquilo-C₁-C₈, cicloalquilo-C₁-C₈, tri(alquilo-C₁-C₈)silyl-cicloalquilo-C₁-C₈, un halogenoalquilo-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno-C₂-C₈, un alquino-C₂-C₈, un alqueno-C₂-C₈, un alquino-C₂-C₈, un alquilamino-C₁-C₈, un di-
- 15 alquilamino-C₁-C₈, un alcoxi-C₁-C₈, un halogenoalcoxi-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfenilo-C₁-C₈, un halogenoalquilsulfenilo C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno-C₂-C₈, un halogenoalqueno-C₂-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquino-C₃-C₈, un halogenoalquino-C₃-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilcarbonilo-C₁-C₈, un halogenoalquilcarbonilo-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilcarbamoilo-C₁-C₈, un di-alquilcarbamoilo-C₁-C₈, un N- alquiloalquilcarbamoilo-C₁-C₈, un alcoxycarbamoilo-C₁-C₈, un N-alquil-C₁-C₈-alcoxycarbamoilo-C₁-C₈, un alcoxycarbonil-C₁-C₈, un halogenoalcoxycarbonil-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilcarboniloxi-C₁-C₈, un halogenoalquilcarboniloxi-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilcarbonilamino-C₁-C₈, un halogenoalquilcarbonilamino-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxycarbonilamino-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxycarbonilamino-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloaminocarboniloxi-C₁-C₈, un di- alquilaminocarboniloxi-C₁-C₈, un alquiloalquilaminocarboniloxi-C₁-C₈, un alquilsulfenilo-C₁-C₈, un halogenoalquilsulfenilo-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfenilo-C₁-C₈, un halogenoalquilsulfenilo-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo-C₁-C₈-sulfonilo, un halogeno-alquil-C₁-C₈-sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilaminosulfamoilo-C₁-C₈, un di- alquilaminosulfamoilo-C₁-C₈, un (alcoxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆, un (alquenoalquenoimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆, (alquenoalquenoimino)-alquilo-C₁-C₆, alcoxialquilo-C₁-C₈, halogenoalcoxialquilo-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfenilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfenilo o fenilamino ;
- 35 • el término "arilo" se refiere a fenilo o naftilo;

- El término "heterociclilo" se refiere a un anillo saturado o insaturado, de 4, 5, 6 ó 7 miembros, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S.

5 Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que X representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un alcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un grupo ciano, un grupo metanosulfonilo, un grupo nitro, un grupo trifluorometilo o un grupo arilo.

10 Entre los átomos de halógeno representados por X, es particularmente preferido un átomo de cloro o un átomo de flúor.

El grupo alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir representado por X es preferiblemente un grupo alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono y ejemplos específicos de los mismos incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo y un grupo terc-butilo. Entre estos grupos alquilo, se prefiere particularmente un grupo metilo o un grupo terc-butilo.

15 El grupo alcoxi por X es preferiblemente un grupo alcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 3 átomos de carbono y ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi y un grupo isopropoxi. Entre estos grupos alcoxi, se prefiere particularmente un grupo metoxi o un grupo etoxi.

20 Los compuestos incluso más referidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que X representa un átomo de hidrógeno;

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Y representa un grupo alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir. Entre estos grupos alquilo, es preferible un grupo alquilo que tiene de 1 a 3 átomos de carbono, tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo o un grupo isopropilo. Entre los grupos alquilo, es particularmente preferido un grupo metilo.

30 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Q representa un cicloalquil-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, alquinilo-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxialquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alqueniloxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalqueniloxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquiniloxi-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi sustituido, fenoxi sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin

sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-halogenoalquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado o insaturado
 5 que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S y que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; bicicloalquilo condensado-C₅-C₁₂ sustituido o sin sustituir, bicicloalqueno condensado C₅-C₁₂ sustituido o sin sustituir.

Compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Q
 10 representa un cicloalquilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalqueno-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, alquino-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alquenoalcoxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, alquinoalcoxi C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquinoalcoxi- C₃-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,
 15 benciloalcoxi sustituido, fenoxi sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S.

20

Compuestos incluso más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Q representa un cicloalquilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, alquino-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alquenoalcoxi C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, alquinoalcoxi-C₃-C₈
 25 sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S.

30

Compuestos incluso más particularmente preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Q representa un cicloalquilo-C₅-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, alquino-C₄-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₄-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxi-alquilo-[C₁-C₃] sustituido o sin sustituir, alquenoalcoxi-C₄-C₈ sustituido o sin
 35 sustituir, alquinoalcoxi-C₄-C₈ sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7

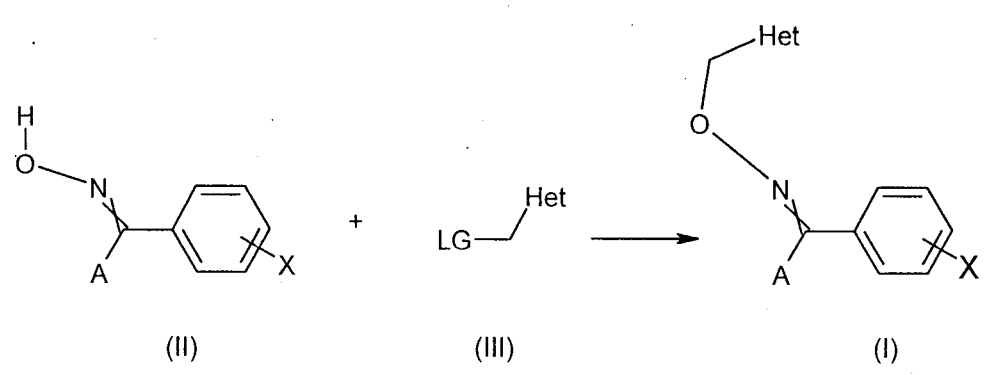
miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S.

Las preferencias mencionadas anteriormente con respecto a los sustituyentes de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden combinarse de diversas maneras. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan de esta manera subclases de compuestos de acuerdo con la invención. Los ejemplos de dichas subclases de compuestos preferidos de acuerdo con la invención pueden combinar:

- características preferidas de X con características preferidas de uno o más de A¹, A², Y, Het¹, Het² y Q ;
- características preferidas de A¹ con características preferidas de uno o más de X, A², Y, Het¹, Het² y Q ;
- características preferidas de A² con características preferidas de uno o más de X, A¹, Y, Het¹, Het² y Q ;
- características preferidas de Y con características preferidas de uno o más de X, A², A¹, Het¹, Het² y Q ;
- características preferidas de Het¹ con características preferidas de uno o más de X, A¹, A², Y, Het² y Q ;
- características preferidas de Het² con características preferidas de uno o más de X, A¹, A², Y, Het¹ y Q ;
- características preferidas de Q con características preferidas de uno o más de X, A¹, A², Y, Het¹ y Het².

En estas combinaciones de características preferidas de los sustituyentes de los compuestos de acuerdo con la invención, dichas características preferidas también pueden seleccionarse entre las características más preferidas de cada uno de X, A¹, A², Y, Het¹, Het² y Q ; para formar subclases aún más preferidas de compuestos de acuerdo con la invención.

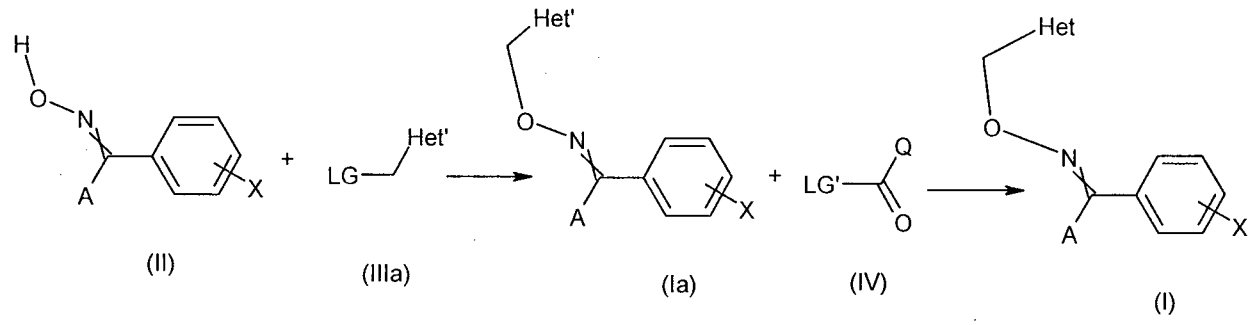
La presente invención se refiere también a un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I). Así, según un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P1 para la preparación de compuestos de fórmula (I), como se define en la presente memoria, como ilustra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



Procedimiento P1

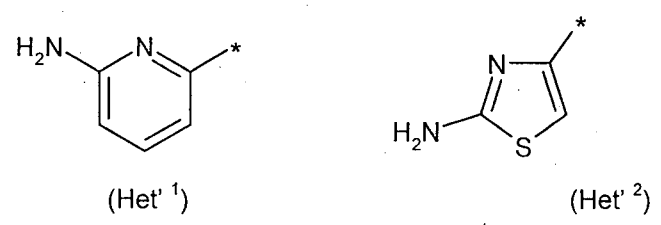
en el que A, X, Z, Q y Het son como se definen en la presente memoria y LG representa un grupo saliente. Los grupos salientes adecuados se pueden seleccionar de la lista que consiste en un átomo de halógeno u otros grupos nucleófilos habituales tales como triflato, mesilato o tosilato.

Para los compuestos de fórmula (I) según la invención, se proporciona un segundo procedimiento P2 para suministrar un compuesto de fórmula (I), según métodos conocidos. En tal caso, se proporciona un procedimiento P2 de acuerdo con la invención y dicho procedimiento P2 puede ilustrarse por el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P2

en donde A, X, Q son como se definen en la presente memoria, Het' representa un grupo piridilo de fórmula (Het' ¹) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het' ²) ;



en donde LG' representa un grupo saliente. Los grupos salientes adecuados pueden seleccionarse de la lista que consiste en un átomo de halógeno u otros grupos nucleófilos habituales tales como alcoholato, hidróxido, carboxilato o cianuro.

Para los compuestos de fórmula (Ia), llevar a cabo el procedimiento P2 requeriría previamente una etapa de desprotección para proporcionar el grupo amino. Los grupos protectores de amino y métodos relacionados de escisión de los mismos son conocidos y pueden encontrarse en T.W. Greene y P.G.M. Wuts, *Protective Group in Organic Chemistry*, 3ª ed., John Wiley & Sons.

5

De acuerdo con la invención, los procedimientos P1 y P2 pueden realizarse, si es apropiado, en presencia de un disolvente y, si es apropiado, en presencia de una base.

De acuerdo con la invención, los procedimientos P1 y P2 pueden realizarse, si es apropiado, en presencia de un catalizador. El catalizador adecuado se puede seleccionar de la lista que consiste en 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

En caso de que LG' represente un grupo hidroxilo, el procedimiento P2 de acuerdo con la presente invención puede realizarse en presencia de un agente de condensación. Un agente de condensación adecuado se puede seleccionar de la lista que consiste en formador de haluros de ácido, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido-tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; un formador de anhídridos, tal como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensadores habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1,3,5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio hidratado o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfonio.

Los disolventes adecuados para realizar los procedimientos P1 y P2 de acuerdo con la invención son disolventes orgánicos inertes convencionales. Se da preferencia a la utilización opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-terc-butilico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o isobutironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metil-pirrolidona o triamida hexametilfosfórica; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo o sulfonas, tales como sulfolano.

35

Las bases adecuadas para realizar los procedimientos P1 y P2 de acuerdo con la invención son bases inorgánicas y orgánicas que son convencionales para tales reacciones. Se prefiere la utilización de hidruros, hidróxidos o alcóxidos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como

hidróxido sódico, hidruro sódico, hidróxido cálcico, hidróxido potásico, terc-butóxido potásico u otro hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como acetato sódico, acetato potásico, acetato cálcico, y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, *N,N*-dimetilnilina, piridina, *N*-metilpiperidina, *N,N*-dimetilaminopiridina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN) o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

10 Cuando se realizan los procedimientos P1 y P2 de acuerdo con la invención, la temperatura de reacción puede variarse independientemente dentro de un intervalo relativamente amplio.

En general, el procedimiento P1 de acuerdo con la invención se realiza a temperaturas comprendidas entre -20°C y 160°C.

15 En general, los procedimientos P1 y P2 de acuerdo con la invención se realizan independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, también es posible operar a presión elevada o reducida.

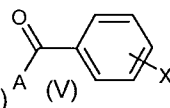
20 Cuando se lleva a cabo el procedimiento P1 según la invención, generalmente se emplea 1 mol o un exceso de derivado de fórmula Het-CH₂-LG y de 1 a 3 moles de base por mol de hidroximoiil tetrazol de fórmula (II). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

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

30 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden preparar de acuerdo con los procedimientos descritos anteriormente. No obstante, debe entenderse que, en base a su conocimiento general y a las publicaciones disponibles, el experto en la materia será capaz de adaptar estos procedimientos a las características de cada uno de los compuestos de acuerdo con la invención que se desean sintetizar.

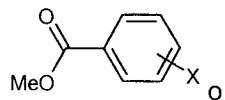
35 Cuando A representa un sustituyente de fórmula A¹, como se describe en la presente memoria, se pueden preparar los compuestos de fórmula (II), útiles como material de partida, por ejemplo

haciendo reaccionar hidroxilamina con las cetonas correspondientes de fórmula (V)

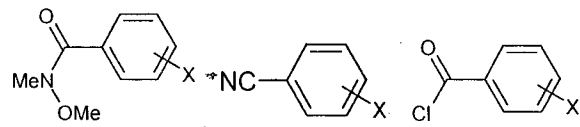


que se pueden preparar, por ejemplo, según el método descrito por R. Raap (*Can. J. Chem.* 1971,

49, 2139) por adición de una especie de tetrazolil litio a ésteres de fórmula

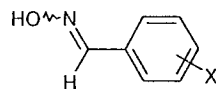


cualquiera de sus equivalentes sintéticos adecuados, como por ejemplo :



Cuando A representa un sustituyente de fórmula A², como se describe en la presente memoria, se pueden preparar los compuestos de fórmula general (II) útiles como material de partida, por

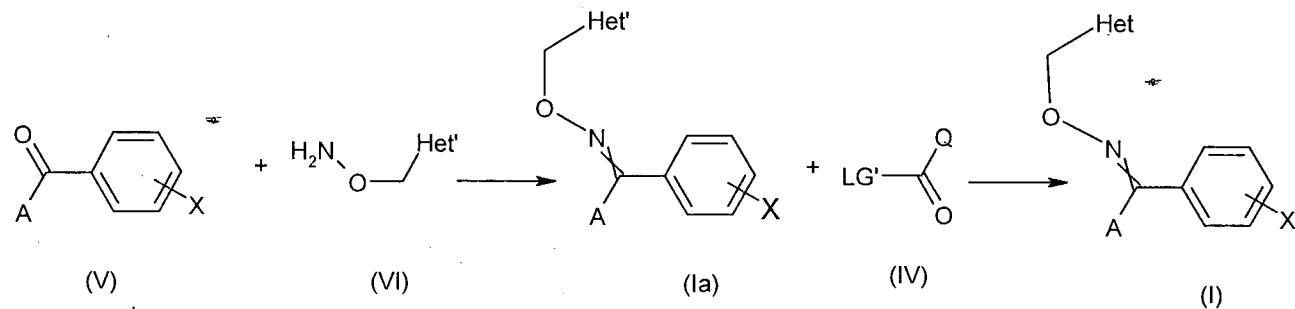
ejemplo, a partir de oximas de fórmula



tetrazol sustituido en 5 según el método

descrito por J. Pleniewicz et al. (*Bull. Soc. Chim. Belg.* 1987, 96, 675).

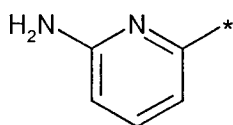
La presente invención se refiere también a un nuevo procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I). Así, según un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P3 para la preparación de compuestos de fórmula (I), como se define en la presente memoria, como ilustra el siguiente esquema de reacción:



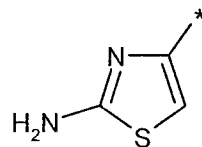
Procedimiento P3

en donde A, X, Q son como se definen en la presente memoria, Het' representa un grupo piridilo de

fórmula (Het' ¹) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het' ²) ;



(Het' ¹)



(Het' ²)

y LG' representa un grupo saliente.

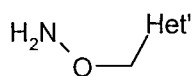
Los grupos salientes adecuados pueden seleccionarse de la lista que consiste en un átomo de halógeno u otros grupos nucleófilos habituales tales como alcoholato, hidróxido, carboxilato o cianuro.

La primera etapa del procedimiento P3 según la invención, es decir, la conversión del compuesto de fórmula (V) en un compuesto de fórmula (Ia) se lleva a cabo a temperaturas entre 110°C y 180°C.

Cuando se lleva a cabo la primera etapa del procedimiento P3 según la invención, es decir, la conversión del compuesto de fórmula (V) en un compuesto de fórmula (Ia), la reacción se realiza con irradiación de microondas.

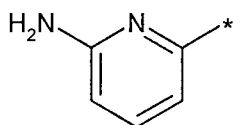
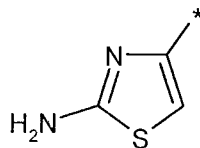
10

En un aspecto adicional, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula (VI) o una de sus sales útiles como compuestos intermedios o materiales para el procedimiento de preparación P3 según la invención. Por lo tanto, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (VI)



(VI)

o una de sus sales, en donde Het' representa un grupo piridilo de fórmula (Het' ¹) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het' ²) :

(Het' ¹)(Het' ²)

En un aspecto adicional, la presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un compuesto activo de fórmula (I).

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" se refiere a una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para luchar contra, o destruir, los hongos presentes o que pueden aparecer en los cultivos, y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo dependiendo del hongo que se vaya a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención. Esta cantidad se puede determinar por ensayos de campo sistemáticos, que están dentro de las capacidades de un experto en la materia.

Así, de acuerdo con la invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I), como se define en la presente memoria y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

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

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

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

En general, la composición de acuerdo con la invención puede contener de 0,05 a 99% en peso de compuesto activo, preferiblemente, de 10 a 70% en peso.

Las composiciones de acuerdo con la invención se pueden utilizar en diversas formas, tales como: dispensador de aerosol, suspensión en cápsulas, concentrado para fumigación en frío, polvo de espolvoreo, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, granulados encapsulados, granulados finos, concentrado fluido para el tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, granulados, concentrado para fumigación en caliente, macrogranulados, microgranulados, polvo dispersable en aceite, concentrado fluido miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, bastoncillos vegetales, polvo para tratamiento de semillas

en seco, semillas recubiertas de pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, disolución para el tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluido), líquido en volumen ultrabajo (vub), suspensión en volumen ultrabajo (vub), granulado o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, granulados o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humectable. Estas composiciones incluyen no sólo composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla que se tiene que tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo pulverizador o de aplicación de polvo fino, sino también las composiciones concentradas comerciales que deben diluirse antes de la aplicación al cultivo.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden mezclarse también con una o más sustancias activas insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen un espectro de actividad más amplio. Las mezclas con otros compuestos fungicidas son particularmente ventajosas. La composición de acuerdo con la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida también puede ser particularmente ventajosa.

De acuerdo con otro objeto de la presente invención, se proporciona un método para luchar contra los hongos fitopatógenos de plantas, cultivos o semillas, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz agronómica y sustancialmente no fitotóxica de una composición pesticida de acuerdo con la invención como tratamiento de semillas, aplicación foliar, aplicación en el tallo, aplicación por empapado o por goteo (irrigación química) a la semilla, la planta o al fruto de la planta, o al suelo o a un sustrato inerte (por ejemplo, sustratos inorgánicos como arena, lana mineral, lana de vidrio; minerales expandidos como perlita, vermiculita, zeolita o arcilla expandida), piedra pómez, materiales piroclásticos o toba volcánica, sustratos orgánicos sintéticos (por ejemplo, poliuretano), sustratos orgánicos (por ejemplo, turba, compost, productos arbóreos de desecho como fibra de coco, fibra de madera o astillas, tronco de árbol) o a un sustrato líquido (por ejemplo, sistemas hidropónicos flotantes, técnica de la película nutriente (NFT), aeropónicos) en el que la planta está creciendo o en el que se desea que crezca.

La expresión "se aplican a las plantas que se van a tratar" se comprende que quiere decir, para los fines de la presente invención, que la composición pesticida que es el objeto de la invención puede aplicarse por medio de diversos métodos de tratamiento tales como:

- atomización de las partes aéreas de dichas plantas con un líquido que comprende una de dichas composiciones,
- espolvoreo, incorporación de gránulos o polvos en el suelo, pulverización, alrededor de dichas plantas y, en el caso de los árboles, inyección o embadurnado,
- recubrimiento o recubrimiento pelicular de las semillas de dichas plantas con ayuda de una mezcla fitoprotectora que comprende una de dichas composiciones.

El método de acuerdo con la invención puede ser un método de curado, de prevención o de erradicación.

En este método, una composición utilizada puede prepararse previamente mezclando dos o más compuestos activos de acuerdo con la invención.

5 Según una alternativa de tal método, también es posible aplicar de forma simultánea, sucesiva o por separado los compuestos (A) y (B) de manera que se tengan los efectos (A)/(B) conjugados de las distintas composiciones que contienen cada una uno de los dos o tres ingredientes activos (A) o (B).

10 La dosis del compuesto activo aplicada habitualmente en el método de tratamiento de acuerdo con la invención es en general y de forma ventajosa

- para tratamiento foliar: de 0,1 a 10,000 g/ha, preferiblemente de 10 a 1,000 g/ha, más preferiblemente de 50 a 300 g/ha; en caso de aplicación por empapado o por goteo, la dosis puede incluso reducirse, especialmente mientras se utilizan sustratos inertes como
- 15 lana mineral o perlita;
- para tratamiento de semillas: de 2 a 200 g por 100 kilogramos de semillas, preferiblemente de 3 a 150 g por 100 kilogramos de semillas;
- para tratamiento del suelo: de 0,1 a 10,000 g/ha, preferiblemente de 1 a 5,000 g/ha.

20 Las dosis indicadas en la presente invención se proporcionan como ejemplos ilustrativos del método de acuerdo con la invención. Un experto en la materia sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación, en particular según la naturaleza de la planta o del cultivo a tratar.

En condiciones específicas, por ejemplo según la naturaleza del hongo fitopatógeno que se debe tratar o contra el que se debe luchar, una dosis menor puede ofrecer una protección adecuada. Ciertas condiciones climáticas, resistencia u otros factores como la naturaleza de los hongos

25 fitopatógenos o al grado de infección, por ejemplo, de las plantas con estos hongos, pueden requerir dosis mayores de ingredientes activos combinados. La dosis óptima depende habitualmente de varios factores, por ejemplo, del tipo de hongo fitopatógeno que se ha de tratar, del tipo o nivel de desarrollo de la planta infestada, de la densidad de vegetación o, alternativamente, del método de aplicación.

30 Sin que sea una limitación, el cultivo tratado con la composición o combinación pesticida de acuerdo con la invención es, por ejemplo, la vid, pero éste puede ser cereales, verduras, alfalfa, soja, cultivos hortícolas, césped, madera, plantas arbóreas u hortícolas.

El método de tratamiento de acuerdo con la invención puede servir también para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o siembras de

35 plántulas y plantas o siembras de plantas. Este método de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El método de tratamiento de acuerdo con la invención también puede servir para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o vástagos, hojas, flores y frutos de la planta en cuestión.

Entre las plantas que se pueden proteger por el método de acuerdo con la invención, puede citarse el algodón; el lino; la vid; cultivos de frutas o verduras tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo, frutas de pepita tales como manzanas y peras, pero también frutas de hueso tales como albaricoques, almendras y melocotones), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp.,
 5 *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo plátanos y plantas de plátanos), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp.,
 10 *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); grandes cultivos tales como *Graminae* sp. (por ejemplo, maíz, césped o cereales como el trigo, arroz, cebada y tritical), *Asteraceae* sp. (por ejemplo, girasol), *Cruciferae* sp. (por ejemplo, colza), *Fabaceae* sp. (por ejemplo cacahuetes), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

15

El método de tratamiento de acuerdo con la invención puede utilizarse en el tratamiento de organismos modificados genéticamente (GMO), por ejemplo, plantas o semillas. Las plantas modificadas genéticamente (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado de manera estable un gen heterólogo en el genoma. La expresión "gen heterólogo" significa esencialmente un gen que se
 20 proporciona o construye fuera de la planta y que cuando se introduce en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial proporciona a la planta transformada nuevas o mejoradas propiedades agronómicas u otras propiedades mediante la expresión de una proteína o polipéptido de interés o disminuyendo o silenciando otros genes que están presentes en la planta (utilizando, por ejemplo, tecnología antisentido, tecnología de co-supresión o tecnología de interferencia de ARN – ARNi). Un
 25 gen heterólogo que está localizado en el genoma también se denomina un transgén. Un transgén que está definido por su particular localización en el genoma de la planta se denomina un evento de transformación o transgénico.

30

Dependiendo de la especie de planta o de la variedad de la planta cultivada, su localización y sus condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede producir efectos superaditivos ("sinérgicos"). Así, por ejemplo, son posibles relaciones de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un incremento de la actividad de los compuestos y composiciones activos que pueden utilizarse de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de la planta, tolerancia incrementada a temperaturas altas o bajas, tolerancia incrementada a la sequía o al agua o al contenido en sal del suelo,
 35 incremento en el rendimiento de la floración, recolección más fácil, maduración acelerada, rendimientos de cosecha mayores, frutos más grandes, mayor altura de la planta, color de la hoja más verde, floración temprana, mayor calidad y/o valor nutricional más alto de los productos

cosechados, mayor concentración de azúcar en los frutos, mejor estabilidad en el almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados, lo que supera los efectos que eran de esperar.

- Con determinadas relaciones de aplicación, las combinaciones del compuesto activo de acuerdo con la invención también pueden tener un efecto reforzador en las plantas. De acuerdo con esto, también son adecuados para movilizar el sistema de defensa de la planta frente al ataque de hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados. Esta puede ser, si resulta apropiado, una de las razones de la actividad incrementada de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo, frente a hongos. Debe entenderse que las sustancias que refuerzan la planta (que inducen resistencia) significan, en el presente contexto, aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas de manera tal que cuando se inoculan posteriormente con hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados, las plantas tratadas muestran un grado de resistencia sustancial frente a esos hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos. En el caso presente, debe entenderse que los hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados significan hongos, bacterias y virus fitopatógenos. Así, las sustancias de acuerdo con la invención pueden emplearse para proteger a las plantas frente al ataque de los patógenos mencionados anteriormente en un periodo de tiempo determinado después del tratamiento. El periodo de tiempo en el que se produce la protección se extiende generalmente de 1 a 10 días, preferiblemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los compuestos activos.
- Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que se tratan preferiblemente de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que tienen material genético que proporciona características útiles particularmente ventajosas a estas plantas (ya sean obtenidas por reproducción y/o por medios biotecnológicos).
- Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que preferiblemente también se tratan de acuerdo con la invención son resistentes frente a uno o más estreses bióticos, es decir, dichas plantas muestran una mejor defensa frente a plagas animales y microbianas, tales como frente a nematodos, insectos, ácaros, hongos, bacterias virus y/o viroides fitopatógenos.
- Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son aquellas plantas que son resistentes a uno o más estreses abióticos. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a bajas temperaturas, exposición al calor, estrés osmótico, inundación, salinidad del suelo incrementada, exposición a minerales incrementada, exposición a ozono, exposición a mucha luz, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo, falta de sombra.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que también pueden tratarse de acuerdo con la invención, son aquellas plantas caracterizadas por unas características de rendimiento

incrementadas. El rendimiento incrementado en dichas plantas puede ser el resultado, por ejemplo, de una mejora de la fisiología de la planta, crecimiento y desarrollo, tal como eficacia en el uso del agua, eficacia en la retención del agua, utilización mejorada del nitrógeno, asimilación incrementada del carbono, fotosíntesis mejorada, eficacia incrementada de la germinación y maduración acelerada. El rendimiento puede verse afectado además por una arquitectura mejorada de la planta (en condiciones de estrés y sin estrés), incluyendo, pero sin limitarse a floración temprana, control de la floración para la producción de semillas híbridas, vigor de la siembra, tamaño de la planta, número y distancia de los entrenudos, crecimiento de la raíz, tamaño de la semilla, tamaño del fruto, tamaño de la vaina, número de vainas o espigas, número de semillas por vaina o espiga, masa de semillas, relleno incrementado de las semillas, dispersión reducida de las semillas, dehiscencia reducida de la vaina y resistencia a la caída. Las características de rendimiento adicionales incluyen composición de las semillas, tales como contenido en carbohidratos, contenido en proteínas, contenido en aceite y composición del aceite, valor nutricional, reducción de compuestos anti-nutricionales, procesabilidad mejorada y mejor estabilidad en el almacenamiento.

Las plantas que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas híbridas que expresan la característica de heterosis o vigor del híbrido que resulta generalmente en un mayor rendimiento, vigor, salud y resistencia frente a factores de estrés biótico y abiótico. Dichas plantas se obtienen típicamente cruzando una línea parental macho estéril endogámica (la hembra parental) con otra línea parental macho fértil endogámica (el macho parental). La semilla híbrida se cosecha típicamente a partir de las plantas macho estériles y se vende a los cultivadores. Las plantas macho estériles pueden producirse a veces (por ejemplo, en maíz) por castración, es decir, por la eliminación mecánica de los órganos reproductores masculinos (o flores macho) pero, típicamente, la esterilidad de los machos es el resultado de determinantes genéticos en el genoma de la planta. En este caso, y especialmente cuando la semilla es el producto deseado para cosecharse de las plantas híbridas es típicamente útil asegurarse de que se ha restaurado completamente la fertilidad de los machos en las plantas híbridas. Esto puede conseguirse asegurando que los machos parentales tienen los genes de restauración de la fertilidad apropiados que son capaces de restaurar la fertilidad de los machos en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad de los machos. Los determinantes genéticos para la esterilidad de los machos pueden estar localizados en el citoplasma. Los ejemplos de esterilidad masculina citoplásmica (CMS) se describieron, por ejemplo, en especies de Brassica (WO 1992/005251, WO 1995/009910, WO 1998/27806, WO 2005/002324, WO 2006/021972 y US 6,229,072). Sin embargo, los determinantes genéticos para la esterilidad de los machos también pueden estar localizados en el genoma nuclear. Las plantas macho estériles también pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética. Un medio particularmente útil para obtener plantas macho estériles se describe en WO 1989/10396 en el que,

por ejemplo, una ribonucleasa tal como barnasa se expresa selectivamente en las células del tapetum en los estambres. Después, la fertilidad puede restaurarse mediante la expresión en las células del tapete de un inhibidor de ribonucleasa tal como barstar (por ejemplo, WO 1991/002069).

- 5 Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas tolerantes a los herbicidas, es decir, plantas que se han hecho tolerantes a uno o más herbicidas dados. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha tolerancia a herbicidas.
- 10 Las plantas tolerantes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato, es decir, plantas que se han hecho tolerantes al herbicida glifosato o a las sales de éste. Las plantas pueden hacerse tolerantes a glifosato mediante diferentes medios. Por ejemplo, las plantas tolerantes a glifosato pueden obtenerse mediante la transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS). Los ejemplos de dichos genes
- 15 EPSPS son el gen AroA (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium* (Comai et al., Science (1983), 221, 370-371), el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.* (Barry et al., Curr. Topics Plant Physiol. (1992), 7, 139-145), los genes que codifican una EPSPS de Petunia (Shalt et al., Science (1986), 233, 478-481), una EPSPS de Tomate (Gasser et al., J. Biol. Chem. (1988), 263, 4280-4289), o una EPSPS de Eleusina (documento WO 2001/66704). También puede
- 20 ser una EPSPS mutada como se describe, por ejemplo, en los documentos EP-A 0837944, WO 2000/066746, WO 2000/066747 o WO 2002/026995. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato óxido-reductasa como se describe en los documentos US 5.776.760 y US 5.463.175. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una
- 25 enzima glifosato acetil transferasa como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2002/036782, WO 2003/092360, WO 2005/012515 y WO 2007/024782. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la selección de plantas que contienen mutaciones naturales de los genes mencionados anteriormente, como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2001/024615 o WO 2003/013226.
- 30 Otras plantas resistentes a herbicidas son, por ejemplo, las plantas que se hacen tolerantes a herbicidas mediante la inhibición de la enzima glutamina sintasa, tal como bialafos, fosfinotricina o glufosinato. Dichas plantas pueden obtenerse mediante la expresión de una enzima que destoxifica el herbicida o una enzima glutamina sintasa mutante que es resistente a la inhibición. Una de dichas enzimas destoxificantes eficaces es una enzima que codifica una fosfinotricin
- 35 acetiltransferasa (tal como la proteína bar o pat de especies de *Streptomyces*). Las plantas que expresan una fosfinotricin acetiltransferasa exógena se describen, por ejemplo, en los documentos US 5.561.236; US 5.648.477; US 5.646.024; US 5.273.894; US 5.637.489; US 5.276.268; US 5.739.082; US 5.908.810 y US 7.112.665.

Las plantas tolerantes a herbicidas adicionales también son plantas que se hacen tolerantes a los herbicidas mediante la inhibición de la enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que el para-hidroxifenilpiruvato (HPP) se transforma en homogentisato. Las plantas tolerantes a inhibidores de HPPD pueden transformarse con un gen que codifica una enzima HPPD resistente natural, o un gen que codifica una enzima HPPD mutada como se describe en WO 1996/038567, WO 1999/024585 y WO 1999/024586. La tolerancia a inhibidores de HPPD también puede obtenerse mediante la transformación de plantas con genes que codifican determinadas enzimas que permiten la formación de homogentisato a pesar de la inhibición de la enzima HPPD nativa por el inhibidor de HPPD. Dichas plantas y genes se describen en WO 1999/034008 y WO 2002/36787. La tolerancia de las plantas a inhibidores de HPPD también puede mejorarse mediante la transformación de plantas con un gen que codifica una enzima prefenato deshidrogenasa además de un gen que codifica una enzima tolerante a HPPD, como se describe en WO 2004/024928.

Aún más, las plantas tolerantes a herbicidas son plantas que se hacen tolerantes a inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS). Los inhibidores de ALS conocidos incluyen, por ejemplo, los herbicidas de tipo sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxtio)benzoatos, y/o sulfonilaminocarbonil triazolinona. Se sabe que diferentes mutaciones en la enzima ALS (también conocida como acetohidroxiácido sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas y grupos de herbicidas, como se describe, por ejemplo, en Tranel y Wright, *Weed Science* (2002), 50, 700-712, y también en los documentos US 5.605.011, US 5.378.824, US 5.141.870 y US 5.013.659. La producción de plantas tolerantes a sulfonilurea y de plantas tolerantes a imidazolinona se describe en los documentos US 5.605.011; US 5.013.659; US 5.141.870; US 5.767.361; US 5.731.180; US 5.304.732; US 4.761.373; US 5.331.107; US 5.928.937; y US 5.378.824; y en la publicación internacional WO 1996/033270. Se describen también otras plantas tolerantes a la imidazolinona, por ejemplo, en los documentos WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351 y WO 2006/060634. Las plantas tolerantes a sulfonilurea y a imidazolinona adicionales también se describen, por ejemplo, en el documento WO 2007/024782.

Otras plantas tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea pueden obtenerse mediante mutagénesis inducida, selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o selección por mutación como se describe, por ejemplo para sojas en el documento US 5.084.082, para arroz en WO 1997/41218, para remolacha en US 5.773.702 y WO 1999/057965, para lechuga en US 5.198.599, o para girasol en WO 2001/065922.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se han hecho resistentes al ataque de determinados insectos diana. Dichas plantas pueden obtenerse mediante

transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha resistencia a insectos.

Una "planta transgénica resistente a insectos", tal y como se utiliza en la presente memoria, incluye cualquier planta que contenga al menos un transgén que comprende una secuencia codificante que codifica:

- 1) una proteína cristal insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una parte insecticida de ésta, tal como las proteínas cristal insecticidas listadas por Crickmore et al., *Microbiology and Molecular Biology Reviews* (1998), 62, 807-813, actualizado por Crickmore et al. (2005) en la nomenclatura de las toxinas de *Bacillus thuringiensis*, en línea en:
10 http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), o partes insecticidas de éstas, por ejemplo, las proteínas de la clase Cry de proteínas Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa o Cry3Bb o partes de éstas insecticidas; o
- 2) una proteína cristal de *Bacillus thuringiensis* o una parte de ésta que es insecticida en presencia de una segunda proteína cristal de *Bacillus thuringiensis* o una parte de ésta, tal
15 como la toxina binaria constituida por las proteínas cristal Cry34 y Cry35 (Moellenbeck et al., *Nat. Biotechnol.* (2001), 19, 668-72; Schnepf et al., *Applied Environm. Microbiol.* (2006), 71, 1765-1774); o
- 3) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas cristal insecticidas de *Bacillus thuringiensis*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o
20 un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo, la proteína Cry1A.105 producida por el maíz transgénico MON98034 (WO 2007/027777); o
- 4) una proteína de uno cualquiera de 1) a 3) anteriores en la que algunos aminoácidos, particularmente de 1 a 10, se han sustituido por otro aminoácido para obtener una mayor actividad insecticida frente a especies de insecto diana, y/o para expandir la gama de
25 especies de insectos diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación, tal como la proteína Cry3Bb1 en los maíces transgénicos MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en el maíz transgénico MIR604;
- 5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una
30 parte insecticida de ésta, tal como las proteínas vegetativas insecticidas (VIP) listadas en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo, proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o
- 6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, tal
35 como la toxina binaria constituida por las proteínas VIP1A y VIP2A (WO 1994/21795); o
- 7) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior; o

8) una proteína de uno cualquiera de 1) a 3) anteriores en la que algunos aminoácidos, particularmente 1 a 10, han sido reemplazados por otro aminoácido para obtener una mayor actividad insecticida frente a especies de insecto diana, y/o para expandir la gama de especies de insectos diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación (aunque todavía codifica una proteína insecticida), tal como la proteína VIP3Aa en el algodón transgénico COT102.

Por supuesto, una planta transgénica resistente a insectos, tal y como se utiliza en la presente memoria, también incluye cualquier planta que comprende una combinación de los genes que codifican las proteínas de una cualquiera de las clases anteriores 1 a 8. En una realización, una planta resistente a insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de una cualquiera de las clases anteriores 1 a 8, para expandir la gama de especies de insectos diana afectadas cuando se utilizan diferentes proteínas dirigidas a diferentes especies de insectos diana, o para retardar el desarrollo de la resistencia a insectos en las plantas utilizando diferentes proteínas insecticidas para las mismas especies de insectos diana pero que tienen un modo de acción diferente, tal como la unión a diferentes sitios de unión del receptor en el insecto.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tal como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son tolerantes a estreses abióticos. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha resistencia al estrés. Las plantas tolerantes al estrés particularmente útiles incluyen:

- a. plantas que contienen un transgén capaz de reducir la expresión y/o la actividad del gen de la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células de la planta o en la planta como se describe en los documentos WO 2000/004173 o WO2006/045633 o PCT/EP07/004142.
- b. plantas que contienen un transgén que incrementa la tolerancia al estrés capaz de reducir la expresión y/o la actividad de los genes que codifican PARP de las plantas o de las células de las plantas, como se describe, por ejemplo, en el documento WO 2004/090140.
- c. plantas que contienen un transgén que incrementa la tolerancia al estrés que codifica una enzima funcional de la planta de la vía de síntesis del dinucleótido de nicotinamida adenina incluyendo nicotinamidasa, nicotinato fosforribosiltransferasa, ácido nicotínico mononucleótido adenil transferasa, dinucleótido de nicotinamida adenina sintetasa o nicotina amida fosforribosiltransferasa como se describe, por ejemplo, en los documentos WO2006/032469 o WO 2006/133827 o PCT/EP07/002433.

5

25

35

documento WO 2000/73422, plantas que producen alternano, como se describe en los documentos WO 2000/047727, EP 06077301.7, US 5.908.975 y EP 0728213.

3) plantas transgénicas que producen hialuronano, como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006/304779, y WO 2005/012529.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas, tales como plantas de algodón, con características alteradas de la fibra. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dichas características alteradas de la fibra e incluyen:

- a) Plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los genes de la celulosa sintasa como se describe en el documento WO 1998/000549
- b) Plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los ácidos nucleicos homólogos de rsw2 o rsw3 como se describe en el documento WO2004/053219
- c) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen una expresión incrementada de la sacarosa fosfato sintasa como se describe en el documento WO 2001/017333
- d) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen una expresión incrementada de la sacarosa sintasa como se describe en el documento WO02/45485
- e) Plantas, tales como plantas de algodón, en las que el control temporal de la apertura de los plasmodesmata en la base de la célula de la fibra está alterado, por ejemplo, a través de una regulación negativa de la β -1,3-glucanasa selectiva de las fibras como se describe en el documento WO2005/017157
- f) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen fibras con una reactividad alterada, por ejemplo, a través de la expresión del gen de la N-acetilglucosaminatransferasa incluyendo los genes nodC y quitinsintasa como se describe en el documento WO2006/136351

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas, tales como colza o plantas Brassica relacionadas, con unas características alteradas del perfil del aceite. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dichas características alteradas del aceite e incluyen:

- a) Plantas, tales como plantas de colza oleaginosa, que producen aceite que tiene un contenido alto en ácido oleico como se describe, por ejemplo, en los documentos US 5.969.169, US 5.840.946 o US 6.323.392 o US 6.063.947
- b) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un contenido bajo

en ácido linolénico como se describe en los documentos US 6.270.828, US 6.169.190 o US 5.965.755

- c) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un nivel bajo de ácidos grasos saturados como se describe, por ejemplo, en el documento US 5.434.283

5

10

15

20

25

30

35

Las plantas transgénicas particularmente útiles que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas que comprenden uno o más genes que codifican una o más toxinas, tales como las siguientes que se venden con los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), BiteGard® (por ejemplo, maíz), Bt-Xtra® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón), Nucotn 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo, maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden con los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas producidas de una manera convencional para la tolerancia a herbicidas) que pueden mencionarse incluyen variedades vendidas con el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz).

Las plantas transgénicas particularmente útiles que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas que contienen eventos de transformación, o combinaciones de eventos de transformación, que se listan, por ejemplo, en las bases de datos de varias agencias reguladoras nacionales o regionales (véase, por ejemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

La composición de acuerdo con la invención también puede usarse contra enfermedades fúngicas susceptibles de desarrollarse sobre madera o en el interior de la misma. El término "madera" significa todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de labores de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y contrachapado. El método para tratar la madera de acuerdo con la invención consiste fundamentalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos de acuerdo con la invención, o con una composición de acuerdo con la invención; éste incluye, por ejemplo, la aplicación directa, la pulverización, la inmersión, la inyección o cualquier otro medio adecuado.

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que pueden combatirse mediante el método de acuerdo con la invención, se pueden mencionar:

Enfermedades por Oídio tales como:

- Enfermedades por *Blumeria*, causadas, por ejemplo, por *Blumeria graminis*;
- Enfermedades por *Podosphaera*, causadas, por ejemplo, por *Podosphaera leucotricha*;
- Enfermedades por *Sphaerotheca*, causadas, por ejemplo, por *Sphaerotheca fuliginea*;
- Enfermedades por *Uncinula*, causadas, por ejemplo, por *Uncinula necator*;
- 5 Enfermedades por roya, tales como:
- Enfermedades por *Gymnosporangium*, causadas, por ejemplo, por *Gymnosporangium sabinae*;
- Enfermedades por *Hemileia*, causadas, por ejemplo, por *Hemileia vastatrix*;
- Enfermedades por *Phakopsora*, causadas, por ejemplo, por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomia*;
- 10 Enfermedades por *Puccinia*, causadas por ejemplo por *Puccinia recondita* ;
- Enfermedades por *Uromyces*, causadas, por ejemplo, por *Uromyces appendiculatus*;
- Enfermedades por Oomicetos tales como:
- Enfermedades por *Bremia* causadas, por ejemplo, por *Bremia lactucae*;
- Enfermedades por *Peronospora*, causadas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *P. brassicae* ;
- 15 Enfermedades por *Phytophthora*, causadas, por ejemplo, por *Phytophthora infestans*;
- Enfermedades por *Plasmopara*, causadas, por ejemplo, por *Plasmopara viticola*;
- Enfermedades por *Pseudoperonospora*, causadas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis* ;
- Enfermedades por *Pythium*, causadas, por ejemplo, por *Pythium ultimum*;
- 20 Enfermedades por manchas foliares, rojeces foliares y tizón foliar tales como:
- Enfermedades por *Alternaria*, causadas, por ejemplo, por *Alternaria solani*;
- Enfermedades por *Cercospora*, causadas, por ejemplo, por *Cercospora beticola*;
- Enfermedades por *Cladosporium*, causadas, por ejemplo, por *Cladosporium cucumerinum*;
- Enfermedades por *Cochliobolus*, causadas, por ejemplo, por *Cochliobolus sativus*;
- 25 Enfermedades por *Colletotrichum*, causadas, por ejemplo, por *Colletotrichum lindemutianum*;
- Enfermedades por *Cicloconium*, causadas, por ejemplo, por *Cicloconium oleaginum*;
- Enfermedades por *Diaporthe*, causadas, por ejemplo, por *Diaporthe citri*;
- Enfermedades por *Elsinoe*, causadas, por ejemplo, por *Elsinoe fawcettii*;
- Enfermedades por *Gloeosporium*, causadas, por ejemplo, por *Gloeosporium laeticolor*;
- 30 Enfermedades por *Glomerella*, causadas, por ejemplo, por *Glomerella cingulata*;
- Enfermedades por *Guignardia*, causadas, por ejemplo, por *Guignardia bidwelli*;
- Enfermedades por *Leptosphaeria*, causadas por ejemplo por *Leptosphaeria maculans* ;
- Leptosphaeria nodorum* ;
- Enfermedades por *Magnaporthe*, causadas, por ejemplo, por *Magnaporthe grisea*;
- 35 Enfermedades por *Mycosphaerella*, causadas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola* ;
- Mycosphaerella arachidicola* ; *Mycosphaerella fijiensis* ;
- Enfermedades por *Phaeosphaeria*, causadas, por ejemplo, por *Phaeosphaeria nodorum*;
- Enfermedades por *Pyrenophora*, causadas, por ejemplo, por *Pyrenophora teres*;

- Enfermedades por *Ramularia*, causadas por ejemplo por *Ramularia colloocygni* ;
- Enfermedades por *Rhynchosporium*, causadas, por ejemplo, por *Rhynchosporium secalis*;
- Enfermedades por *Septoria*, causadas, por ejemplo, por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;
- Enfermedades por *Typhula*, causadas, por ejemplo, por *Typhula incarnata*;
- 5 Enfermedades por *Venturia*, causadas, por ejemplo, por *Venturia inaequalis*;
- Enfermedades del tallo y la raíz tales como :
- Enfermedades por *Corticium*, causadas, por ejemplo, por *Corticium graminarum*;
- Enfermedades por *Fusarium*, causadas, por ejemplo, por *Fusarium oxysporum*;
- Enfermedades por *Gaeumannomyces*, causadas, por ejemplo, por *Gaeumannomyces graminis*;
- 10 Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*;
- Enfermedades por *Tapesia*, causadas, por ejemplo, por *Tapesia acuformis*;
- Enfermedades por *Thielaviopsis*, causadas, por ejemplo, por *Thielaviopsis basicola*;
- Enfermedades de las espigas y panojas, tales como:
- Enfermedades por *Alternaria*, causadas, por ejemplo, por *Alternaria spp.* ; ;
- 15 Enfermedades por *Aspergillus*, causadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*;
- Enfermedades por *Cladosporium*, causadas, por ejemplo, por *Cladosporium spp.* ; ;
- Enfermedades por *Claviceps*, causadas, por ejemplo, por *Claviceps purpurea*;
- Enfermedades por *Fusarium*, causadas, por ejemplo, por *Fusarium culmorum*;
- Enfermedades por *Gibberella*, causadas, por ejemplo, por *Gibberella zeae*;
- 20 Enfermedades por *Monographella*, causadas, por ejemplo, por *Monographella nivalis*;
- Enfermedades por carbón y tizón, tales como:
- Enfermedades por *Sphacelotheca*, causadas, por ejemplo, por *Sphacelotheca reiliana*;
- Enfermedades por *Tilletia*, causadas, por ejemplo, por *Tilletia caries*;
- Enfermedades por *Urocystis*, causadas, por ejemplo, por *Urocystis occulta*;
- 25 Enfermedades por *Ustilago*, causadas, por ejemplo, por *Ustilago nuda*;
- Enfermedades por podredumbre y moho de la fruta tales como
- Enfermedades por *Aspergillus*, causadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*;
- Enfermedades por *Botrytis*, causadas, por ejemplo, por *Botrytis cinerea*;
- Enfermedades por *Penicillium*, causadas, por ejemplo, por *Penicillium expansum*;
- 30 Enfermedades por *Sclerotinia*, causadas, por ejemplo, por *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Enfermedades por *Verticillium*, causadas por ejemplo por *Verticillium alboatrum* ;
- Enfermedades por putrefacción de las semillas y del suelo, moho, marchitamiento, podredumbre y caída de almáciga:
- Enfermedades por *Alternaria* causadas, por ejemplo, por *Alternaria brassicicola*;
- 35 Enfermedades por *Aphanomyces* causadas, por ejemplo, por *Aphanomyces euteiches*;
- Enfermedades por *Ascochyta*, causadas, por ejemplo, por *Ascochyta lentis*;
- Enfermedades por *Aspergillus*, causadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*;
- Enfermedades por *Cladosporium*, causadas, por ejemplo, por *Cladosporium herbarum*;

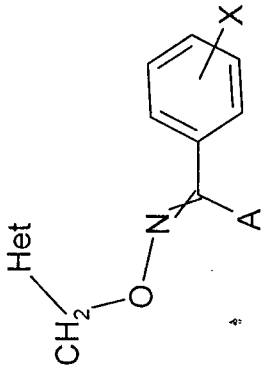
- Enfermedades por Cochliobolus, causadas, por ejemplo, por *Cochliobolus sativus*;
(En forma de conidio: *Drechslera*, *Bipolaris* Sinónimo: *Helminthosporium*);
- Enfermedades por Colletotrichum, causadas, por ejemplo, por *Colletotrichum coccodes*;
- Enfermedades por Fusarium, causadas, por ejemplo, por *Fusarium culmorum*;
- 5 Enfermedades por Gibberella, causadas, por ejemplo, por *Gibberella zeae*;
- Enfermedades por Macrophomina, causadas, por ejemplo, por *Macrophomina phaseolina*;
- Enfermedades por Monographella, causadas, por ejemplo, por *Monographella nivalis*;
- Enfermedades por Penicillium, causadas, por ejemplo, por *Penicillium expansum*;
- Enfermedades por Phoma, causadas, por ejemplo, por *Phoma lingam*;
- 10 Enfermedades por Phomopsis, causadas, por ejemplo, por *Phomopsis sojae*;
- Enfermedades por Phytophthora, causadas, por ejemplo, por *Phytophthora cactorum*;
- Enfermedades por Pyrenophora, causadas, por ejemplo, por *Pyrenophora graminum*;
- Enfermedades por Pyricularia, causadas, por ejemplo, por *Pyricularia oryzae*;
- Enfermedades por Pythium, causadas, por ejemplo, por *Pythium ultimum*;
- 15 Enfermedades por Rhizoctonia, causadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*;
- Enfermedades por Rhizopus, causadas, por ejemplo, por *Rhizopus oryzae*;
- Enfermedades por Sclerotium, causadas, por ejemplo, por *Sclerotium rolfsii*;
- Enfermedades por Septoria, causadas, por ejemplo, por *Septoria nodorum*;
- Enfermedades por Typhula, causadas, por ejemplo, por *Typhula incarnata*;
- 20 Enfermedades por Verticillium, causadas, por ejemplo, por *Verticillium dahliae*;
- Enfermedades por cancro, escoba, puntisecho tales como :
- Enfermedades por Nectria, causadas, por ejemplo, por *Nectria galligena*;
- Enfermedades por tizón, tales como :
- Enfermedades por Monilinia, provocadas por ejemplo por *Monilinia laxa*;
- 25 Enfermedades por ampolla de la hoja o rizado de la hoja, tales como :
- Enfermedades por Taphrina, causadas, por ejemplo, por *Taphrina deformans*;
- Enfermedades de deterioro de plantas madereras, tales como
- Enfermedades por Esca, causadas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora* ;
- Muerte regresiva por Eutypa, causada por ejemplo por *Eutypa lata* ;
- 30 Enfermedad holandesa del olmo, causada por ejemplo por *Ceratocystis ulmi* ;
- Enfermedades de flores y semillas tales como:
- Enfermedades por Botrytis, causadas, por ejemplo, por *Botrytis cinerea*;
- Enfermedades de tubérculos, tales como:
- Enfermedades por Rhizoctonia, causadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*;
- 35 Enfermedades por Helminthosporium, causadas, por ejemplo, por *Helminthosporium solani*;

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas humanas o

animales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades por *Trichophyton* y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus* spp., por ejemplo *Aspérgillus fumigatus*.

Los diversos aspectos de la invención se ilustrarán ahora con referencia a la siguiente
5 tabla 1 de ejemplos de compuestos y la siguiente preparación o ejemplos de eficacia.

La siguiente tabla 1 ilustra de una manera no limitante ejemplos de compuestos de acuerdo con la invención.



En la tabla 1 se usan las siguientes abreviaturas para los elementos reivindicados específicos “Het” de la estructura genérica (I) de la invención:

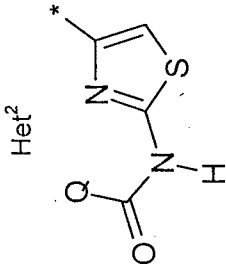
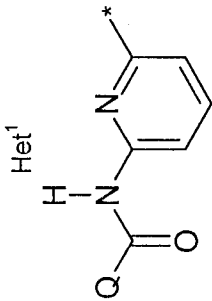
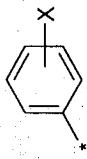
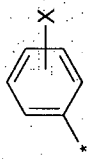
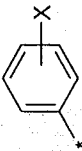


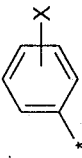
Tabla 1

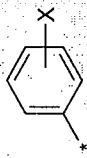
Ej.	A	Het	Q	PM_medido	log P
1	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	4-etoxifenil	458*	3,69
2	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]metil	500*	3,48
3	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	difluoro(fenoxi)metil		3,94
4	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	difluoro(3-metilfenoxi)metil		4,26
5	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	difluoro(4-metilfenoxi)metil		4,26
6	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	difluoro(fenilsulfanil)metil		4,11
7	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	difluoro[(4-metilfenil)sulfanil]metil		4,44
8	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	2-ciclopentiletil	452	4,26
9	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	2-ciclohexiletil	466	4,65
10	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	2-fenoxietil	476	3,64
11	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	prop-2-en-1-iloxi	412	3,29

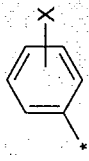
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
12	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-3-en-1-iloxi	426	3,58
13	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	424	3,21
14	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-2-in-1-iloxi	424	3,37
15	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	but-3-in-1-iloxi	412	2,88
16	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	prop-2-in-1-iloxi	398	2,75
17	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	406	3,15
18	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	but-2-in-1-iloxi	406	3,29
19	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	but-3-en-1-iloxi	408	3,55
20	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-clorobutoxi	444	3,73
21	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	cicloheptiloxi	450	4,71
22	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-(benciloxi)etoxi	488	3,83
23	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	424	3,21
24	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-2-in-1-iloxi	424	3,39
25	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-(benciloxi)etoxi	506	3,92
26	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-(benciloxi)etoxi	512	3,67
27	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-3-en-1-iloxi	426	3,67
28	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	prop-2-en-1-iloxi	412	3,37
29	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	prop-2-en-1-iloxi	418	3,13
30	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	4-clorobutoxi	462	3,83
31	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	4-clorobutoxi	468	3,55
32	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	cicloheptiloxi	468	4,78
33	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	cicloheptiloxi	474	4,39
34	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	pent-4-in-1-ilo	404	3,04
35	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	pent-4-in-1-ilo	422	3,15
36	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	pent-4-in-1-ilo	428	3,04
37	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	tiofen-2-ilmetil	434	3,29
38	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	tiofen-2-ilmetil	452	3,39
39	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	tiofen-2-ilmetil	458	3,23
40	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	ciclohexilmetil	434	4,12
41	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	ciclohexilmetil	452	4,23
42	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-ciclohexiletil	448	4,62
43	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-ciclohexiletil	466	4,7

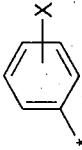
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
44	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-ciclopentiletil	434	4,25
45	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-ciclopentiletil	452	4,33
46	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	fenoximetil	444	3,58
47	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	fenoximetil	462	3,67
48	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	difluoro(fenilsulfanil)metil	496	4,2
49	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-(5-clorotiofen-2-il)etil	482	3,99
50	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	tetrahidro-2H-piran-2-il	422	3,46
51	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-ciclopentiletil	434	4,11
52	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-ciclohexiletil	448	4,51
53	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-fenoxietil	458	3,78
54	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetilciclopropil	501	4,62
55	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	pent-4-in-1-ilo	404	2,98
56	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	prop-2-en-1-iloxi	394	3,21
57	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	but-3-en-1-iloxi	408	3,51
58	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	but-2-in-1-iloxi	406	3,25
59	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	prop-2-in-1-iloxi	392	2,9
60	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-propilfenil	456	4,39
61	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-fenilciclopropil	454	3,85
62	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	biciclo[2.2.1]hept-2-ilmetil	446	4,16
63	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-ciclohexilpropil	462	4,94
64	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	fenoximetil	444	3,53
65	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	ciclohexilmetil	434	4,04
66	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-(benciloxi)etoxi	488	3,76
67	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-clorobutoxi	444	3,67
68	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-fluoroetoxi	400	2,78
69	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	4-propilfenil		4,36
70	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	1-fenilciclopropil	460	3,94
71	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	2-fenilciclopropil		3,78
72	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	2-(5-clorotiofen-2-il)etil		3,83
73	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	tetrahidro-2H-piran-4-il	488	2,49
74	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	3-clorofenilo	454	3,76

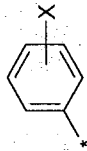
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
75	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	1-fenoxietil	464	3,53
76	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	3-fluorofenil	438	3,42
77	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahidro-2,5-metanopentalen-3a(1H)-il		4,21
78	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	biciclo[2.2.1]hept-5-en-2-il		3,39
79	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	pentadecafluoroheptilo		5,17
80	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	4-etilfenilo		3,96
81	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	6-cloropiridin-3-il		3,13
82	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	tiofen-2-il	426	3,19
83	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	ciclohex-3-en-1-il		3,42
84	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	ciclopropilmetil		2,9
85	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	undecafluorociclohexil	624	4,44
86	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	{[(1R,2S,5R)-5-metil-2-(propan-2-il)ciclohexil]oxi}metil		5,48
87	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetilciclopropil		4,49
88	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	2-metilbiciclo[2.2.1]hept-2-il		4,19
89	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	difluoro[(4-metilfenil)sulfanil]metil		4,21
90	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	difluoro(3-metilfenoxi)metil	500	4,04
91	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	difluoro(4-metilfenoxi)metil		4,09
92	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	4-etoxifenil		3,71
93	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	triciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil		4,77
94	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	(1S,3R,5R,7S)-triciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	492	4,73
95	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	metoxi(fenil)metil		
96	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	biciclo[2.2.1]hept-2-ilmetil	452	4,01
97	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]metil		3,37
98	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	(2-clorofenoxi)metil	484	3,62
99	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	4-butoxifenilo		4,51
100	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	He ²	(1,1,1-tricloro-2-metilpropan-2-il)oxi	518	4,39

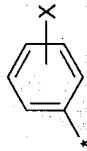
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
101	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	4-(acetiloxi)butoxi		3,04
102	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	(1,7,7-trimetilbencilo[2.2.1]hept-2-il)oxi	496	4,97
103	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	(2-metilprop-2-en-1-il)oxi		3,33
104	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	prop-1-en-2-iloxi	400	2,96
105	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	2,2,2-tricloroetoxi	490	3,71
106	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	morfolin-4-il	423	2,17
107	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	prop-1-en-2-iloxi	394	3,21
108	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2,2,2-tricloroetoxi	484	4,06
109	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	piperidin-1-ilo	421	2,69
110	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	1-fenilciclopropil	454	2,55
111	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-feniletetil	440	3,78
112	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-fenilciclopropil	454	3,94
113	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-(5-clorotiofen-2-il)etil	482	4,06
114	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	3-clorofenilo	448	3,92
115	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	1-fenoxietil	458	3,85
116	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	3-fluorofenil	432	3,48
117	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahidro-2,5-metanopentalen-3a(1H)-il	458	4,29
118	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	bencilo[2.2.1]hept-5-en-2-il	430	3,55
119	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	pentadecafluoroheptilo	706	5,93
120	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-etilfenilo	442	4,01
121	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	6-cloropiridin-3-il	449	3,15
122	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	tiofen-2-il	420	3,29
123	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	ciclohex-3-en-1-il	418	3,58
124	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	ciclopropilmetil	392	2,94
125	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	undecafluorociclohexil	618	4,94
126	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	{[(1R,2S,5R)-5-metil-2-(propan-2-il)ciclohexil]oxi}metil	506	5,95
127	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetilciclopropil	500	4,73
128	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	difluoro[(4-metilfenil)sulfanil]metil	510	4,49

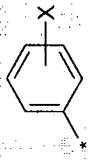
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
129	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	difluoro(3-metilfenoxi)metil	494	4,31
130	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	5-oxotetrahidrofuran-2-il	422	2,44
131	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	difluoro(4-metilfenoxi)metil	494	4,31
132	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-etoxifenil	458	3,78
133	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	tríciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	486	5
134	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(1S,3R,5R,7S)-tríciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	486	5
135	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	biciclo[2.2.1]hept-2-ilmetil	446	4,26
136	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]metil	500	3,53
137	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(2-metoxietoxi)metil	426	2,69
138	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-fluoro-2-(trifluorometil)fenil	500	4,01
139	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	tetrahidro-2H-piran-2-il	422	3,48
140	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(2-clorofenoxi)metil	478	3,92
141	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	[2-(2-metoxietoxi)etoxi]metil	470	2,59
142	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	3-etoxi-3-oxopropil	438	2,92
143	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-butilfenil	470	4,84
144	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(benciloxi)metil	458	3,73
145	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	5-metoxi-5-oxopentil	452	2,86
146	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(3-clorofenoxi)metil	478	3,89
147	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-propilfenil	456	4,49
148	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	4-etoxi-4-oxobutil	452	2,98
149	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(4-clorofenoxi)metil	478	3,96
150	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	1,2,2,2-tetrafluoro-1-(heptafluoropropoxi)etil	622	4,92
151	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	(bencilsulfanil)metil	474	3,73
152	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	3-(4-cloro-2-metilfenoxi)propil	520	4,62
153	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	3-fenoxipropil	472	3,78
154	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	4-propilfenil	480	4,41
155	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	1-fenilciclopropil	478	4,01
156	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(E)-2-feniletetil	464	3,69
157	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-fenilciclopropil	478	3,85

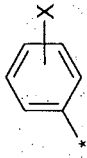
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
158	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	2-(5-clorotiofen-2-il)etil	506	3,94
159	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	3-clorofenilo	472	3,87
160	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	3-fluorofenil	456	3,53
161	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	tridecafluorohexil	680	4,81
162	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	-4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahidroq-2,5-metanopentalen-3a(1H)-il]	482	4,26
163	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	biciclo[2.2.1]hept-5-en-2-il	454	3,48
164	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	pentadecafluoroheptilo	730**	5,17
165	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil	524	3,89
166	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	4-etilfenilo	466	4,04
167	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	6-cloropiridin-3-il	473	3,23
168	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	tiofen-2-il	444	3,27
169	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	ciclohex-3-en-1-il	442	3,48
170	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	ciclopropilmetil	416	2,98
171	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	undecafluorociclohexil	642	4,51
172	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	{[(1R,2S,5R)-5-metil-2-(propan-2-il)ciclohexil]oxi}metil	530	5,47
173	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-dodecafluorohexil	662	4,24
174	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetilciclopropil	524	4,7
175	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	difluoro[(4-metilfenil)sulfanil]metil	534	4,26
176	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	difluoro(3-metilfenoxi)metil	518**	4,14
177	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	2,2-dicloro-1-etil-3-metilciclopropil	512	4,14
178	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	difluoro(4-metilfenoxi)metil	518	4,19
179	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	4-etoxifenil	482**	3,8
180	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	triciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	510**	4,84
181	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	(1S,3R,5R,7S)-triciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	510	4,84
182	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	biciclo[2.2.1]hept-2-ilmetil	470**	4,16
183	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	He ²	(2-metoxietoxi)metil	450	2,68

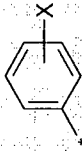
Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
184	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	4-fluoro-2-(trifluorometil)fenil	524	3,92
185	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	tetrahidro-2H-piran-2-il	446	3,27
186	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	[2-(2-metoxietoxi)etoxi]metil	494	2,66
187	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	prop-2-en-1-il	402	2,84
188	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	3-etoxi-3-oxopropil	462	2,9
189	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(3-clorofenoxi)metil	502	3,8
190	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	4-etoxi-4-oxobutil	476**	3,04
191	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(4-clorofenoxi)metil	502**	3,82
192	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	heptafluoropropil	530**	3,75
193	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	1,2,2,2-tetrafluoro-1-(heptafluoropropoxi)etil	646**	4,54
194	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(bencilsulfanil)metil	498	3,68
195	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	3-(4-cloro-2-metilfenoxi)propil	544**	4,46
196	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	3-fenoxipropil	496**	3,7
197	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(1,1,1-tricloro-2-metilpropan-2-il)oxi	536**	4,51
198	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	4-(acetiloxi)butoxi	492**	3,15
199	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(1,7,7-trimetilbiciclo[2.2.1]hept-2-il)oxi	514**	5,05
200	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	but-3-en-1-iloxi	432	3,37
201	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2,2,2-tricloroetoxi	508	3,85
202	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-(benciloxi)etoxi		3,53
203	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	pent-4-in-1-iloxi	410	2,9
204	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	tiofen-2-ilmetil	440	3,09
205	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	ciclohexilmetil	440	3,89
206	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-ciclohexiletil	454	4,3
207	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-ciclopentiletil	440	3,99
208	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	fenoximetil	450	3,31
209	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	tiofen-2-ilmetil	434	3,23
210	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	difluoro(fenilsulfanil)metil		3,85
211	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-ciclohexilpropil	468	4,73
212	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-clorofenilo	448	3,85

Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
213	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-fluorofenil	432	3,48
214	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	tiofen-2-il	420	3,21
215	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-butilfenil	470	4,78
216	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-etilfenilo	442	3,99
217	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-fenoxipropil	472	3,69
218	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	(bencilsulfanil)metil	474	3,73
219	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	5-(acetilsulfanil)pentil	482	3,55
220	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-(tetrahidrofuran-2-il)etil	436	2,77
221	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-(tiofen-3-il)propil	462	3,7
222	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	tiofen-2-ilmetil	440	3,13
223	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	ciclohexilmetil	440	3,96
224	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	2-ciclohexiletil	454	4,41
225	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	2-ciclopentiletil	440	4,06
226	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	fenoximetil	450	3,37
227	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	difluoro(fenilsulfanil)metil	502	3,89
228	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	difluoro(fenoxi)metil	486	3,78
229	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	3-ciclohexilpropil	468	4,82
230	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	2-(benciloxi)etoxi	494	3,58
231	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	feniletinilo	462	3,71
232	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	(Z)-2-cloro-2-feniletetil	498	3,89
233	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	tiofen-3-ilmetil	458	3,21
234	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	pent-4-in-1-ilo	428	3,02
235	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	ciclohexilmetil	458	4,01
236	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-ciclohexiletil	472	4,44
237	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-ciclopentiletil	458	4,11
238	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	fenoximetil	468	3,42
239	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	difluoro(fenilsulfanil)metil	520	3,94
240	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	difluoro(fenoxi)metil	504	3,83
241	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	3-ciclohexilpropil	486	4,84
242	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	1-(4-bromofenoxi)etil	536	4,21
243	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetilciclopropil	506	4,44

Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
244	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(1,1,1-tricloro-2-metilpropan-2-il)oxi	518	4,36
245	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2,2,2-tricloroetoxi	490	3,7
246	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(2,4-diclorofenoxi)metil	518	4,06
247	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(2-clorofenoxi)metil	484	3,61
248	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-clorofenilo	454	3,73
249	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(3-clorofenoxi)metil	484	3,7
250	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(4-clorofenoxi)metil	484	3,68
251	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	6-cloropiridin-3-il	455	3,09
252	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-(5-clorotiofen-2-il)etil	488	3,82
253	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	pentadecafluoroheptilo	712	5,08
254	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	1,2,2,2-tetrafluoro-1-(heptafluoropropoxi)etil	628	4,46
255	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-fluoro-2-(trifluorometil)fenil	506	3,78
256	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]metil	506	3,33
257	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	difluoro(3-metilfenoxi)metil	500	4,04
258	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	difluoro(4-metilfenoxi)metil	500	4,06
259	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	difluoro[(4-metilfenil)sulfanil]metil	516	4,16
260	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	undecafluorociclohexil	624	4,44
261	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-fluorofenil	438	3,39
262	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	1-(4-fluorofenoxi)etil	476	3,79
263	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(4-iodofenoxi)metil	576	3,94
264	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	406	3,09
265	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	prop-2-en-1-iloxi	394	3,27
266	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	-4-[(2R,3aR,5S,6aS)-hexahidro-2,5-metanopentalen-3a(1H)-il]	464	4,14
267	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	1-fenilciclopropil	460	3,87
268	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-butilfenil	476	4,68
269	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-propilfenil	462	4,29
270	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-etilfenilo	448	3,92
271	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-etoxifenil	464	3,64

Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
272	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	tiofen-2-il	426	3,13
273	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	biciclo[2.2.1]hept-5-en-2-il	436	3,33
274	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-fenilciclopropil	460	3,71
275	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	ciclohex-3-en-1-il	424	3,35
276	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	5-oxotetrahidrofuran-2-il	428	2,26
277	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	1-fenoxietil	464	3,53
278	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(1S,3R,5R,7S)- triciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	492	4,69
279	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	triciclo[3.3.1.1 ^{3,7}]dec-1-ilmetil	492	4,69
280	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	biciclo[2.2.1]hept-2-ilmetil	452	4,01
281	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	ciclopropilmetil	398	2,84
282	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-etoxi-3-oxopropil	444	2,73
283	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-etoxi-4-oxobutil	458	2,9
284	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	{[(1R,2S,5R)-5-metil-2-(propan-2-il)ciclohexil]oxi}metil	512	5,39
285	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	[2-(2-metoxietoxi)etoxi]metil	476	2,51
286	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(2-metoxietoxi)metil	432	2,54
287	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(1,7,7-trimetilbiciclo[2.2.1]hept-2-il)oxi	496	4,92
288	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-(acetiloxi)butoxi	474	3
289	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	(bifenil-2-iloxi)metil	526	4,32
290	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	but-2-in-1-iloxi	412	3,04
291	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ²	(benciloxi)metil	464	3,46
292	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	but-3-in-1-iloxi	430	3,02
293	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	but-2-in-1-iloxi	430	3,17
294	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-fluoroetoxi	424	2,77
295	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	3-fluorofenil	Het ²	but-3-en-1-iloxi	432	3,39
296	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	1-metilciclohexil	458	4,16
297	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	4-butilfenil	494	4,81
298	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	5-metoxi-5-oxopentil	476	2,94
299	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-etoxietil	434**	2,78
300	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	3-metoxibutoxi	464	3,13

Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
301	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ²	2-metoxietoxi	436	2,66
302	5-metil-1H-tetrazol-1-ilo	fenilo	Het ¹	2-fluoroetoxi	400	2,84
303	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-metilfenil	Het ¹	2-ciclohexilet	462	4,73
304	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-metilfenil	Het ¹	2-fenoxietil	472	3,67
305	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-clorofenilo	Het ¹	2-ciclohexilet	482	4,7
306	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-metilfenil	428	3,65
307	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-metilfenil	428	3,5
308	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-fluorofenil	432	3,46
309	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-fluorofenil	431	3,52
310	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	4-clorofenilo		3,83
311	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-clorofenilo	448	3,44
312	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-metoxifenilo	444	3,44
313	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	3-etoxifenil	458	3,79
314	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	2-cloropiridin-3-il		2,82
315	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-metilfenil	Het ¹	but-3-en-1-iloxi	422	3,65
316	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-metilfenil	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	420	3,23
317	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²		489	3,83
318	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-(trifluorometil)fenilo	488	3,92
319	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-fenoxifenil	512	4,36
320	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	quinolin-2-il	471	4,04
321	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2,4-difluorofenil	456	3,37
322	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-metoxifenilo	450	3,5
323	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3,5-diclorofenilo	488	4,36
324	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-iodofenil	546	4,01
325	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-(trifluorometoxi)fenilo	504	3,61
326	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-fluorofenil	438	3,39
327	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-metilfenil	434	3,41
328	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-(trifluorometoxi)fenilo	516	3,9
329	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	4-fluorofenil	450	3,57
330	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	4-fenoxifenil	524	4,51
331	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-metilfenil	446	3,61
332	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-cloropiridin-3-il	455	2,73

Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
333	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-clorofenilo	454	3,74
334	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-clorofenilo	454	3,29
335	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	4-metilfenil	434	3,59
336	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2,4-diclorofenilo	488	3,76
337	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-bromofenil	498	3,33
338	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	2-fluorofenil	438	3,27
339	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²		472	3,96
340	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3,5-difluorofenil	456	3,63
341	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil	506	4,11
342	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²		502	3,81
343	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²		518	4,16
344	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	3-bromofenil		3,85
345	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-metoxifenilo	462	3,79
346	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3,5-diclorofenilo	500	4,61
347	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-iodofenil	558	4,21
348	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil	518	4,34
349	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-propoxifenil	490	4,31
350	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-metoxi-5-(trifluorometil)fenil	530	4,59
351	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹		514	3,99
352	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹		530	4,31
353	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-bromofenil	510	4,06
354	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-cloro-4-metilfenil	480	3,9
355	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹		501	4,06
356	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-(trifluorometil)fenilo	500	4,11
357	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-fenoxifenil	524	4,51
358	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	furan-2-il	422	3,04
359	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2,4-difluorofenil	468	3,76
360	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-cloropiridin-3-il	467	2,94
361	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	4-clorofenilo	466	3,94
362	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-clorofenilo	466	3,57
363	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	4-metilfenil	446	3,76
364	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2,4-diclorofenilo	500	4,04

Ej.	A		Het	Q	PM_medido	log P
365	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-bromofenil	510	3,59
366	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	2-fluorofenil	450	3,65
367	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹		484	4,19
368	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3,5-difluorofenil	468	3,83
369	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-etoxifenil	476	3,87
370	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	3-metoxifenil	462	3,55
371	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-metilfenil	Het ¹	4-metilfenil	442	3,81
372	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-clorofenilo	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	440	3,21
373	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	2-clorofenilo	Het ¹	2-fenoxietil	492	3,63
374	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	3-fluorofenil	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	424	3,21
375	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	difluoro(fenoxi)metil	480	3,94
376	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	but-3-in-1-iloxi	412	2,88
377	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ¹	but-3-in-1-iloxi	406	3,09
378	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	fenoximetil	450	3,33
379	1-metil-1H-tetrazol-5-ilo	fenilo	Het ²	fenoximetil	450	3,13

La medida de los valores de logP se ha realizado según la directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía Líquida de alta Resolución, del inglés High Performance Liquid Chromatography) en columnas de fase inversa con los métodos siguientes:

La medición de LC-MS se realizó a pH 2,7 con ácido fórmico al 0,1% en agua y con acetónitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico) como eluyente con un gradiente lineal desde 10% de acetónitrilo hasta 95% de acetónitrilo.

La calibración se hizo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (medición de valores de logP usando tiempos de retención con interpolación lineal entre alcanonas sucesivas). Los valores máximos de lambda se determinaron usando espectros UV de 200 nm a 400 nm y los valores pico de las señales cromatográficas.

En la tabla 1, M+H (ó M H) significa el pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidad de masa atómica) respectivamente, observado en la espectroscopia de masas, y M (Apcl+) significa el pico del ión molecular como se encontró mediante ionización química a presión atmosférica positiva en la espectroscopia de masas

Medición del Peso Molecular, Método:

** LCT-ESI

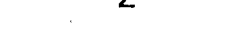
SQD-ESI

E



(I) E

Z



(I) Z

U



(I) U

5
1 (E), 2 (E), 3 (U), 4 (U), 5 (U), 6 (U), 7 (U), 8 (U), 9 (U), 10 (U), 11 (U), 12 (U), 13 (U), 14 (U),
15 (U), 16 (U), 17 (U), 18 (U), 19 (U), 20 (U), 21 (U), 22 (U), 23 (U), 24 (U), 25 (U), 26 (U), 27
(U), 28 (U), 29 (U), 30 (U), 31 (U), 32 (U), 33 (U), 34 (U), 35 (U), 36 (U), 37 (U), 38 (U), 39 (U),
10 40 (U), 41 (U), 42 (U), 43 (U), 44 (U), 45 (U), 46 (U), 47 (U), 48 (U), 49 (Z), 50 (Z), 51 (Z), 52 (Z),
53 (Z), 54 (Z), 55 (Z), 56 (Z), 57 (Z), 58 (Z), 59 (Z), 60 (Z), 61 (Z), 62 (Z), 63 (Z), 64 (Z), 65 (Z),
66 (Z), 67 (Z), 68 (Z), 69 (U), 70 (U), 71 (U), 72 (U), 73 (U), 74 (U), 75 (U), 76 (U), 77 (U), 78 (U),
79 (U), 80 (U), 81 (U), 82 (U), 83 (U), 84 (U), 85 (U), 86 (U), 87 (U), 88 (U), 89 (U), 90 (U), 91
(U), 92 (U), 93 (U), 94 (U), 95 (U), 96 (U), 97 (U), 98 (U), 99 (U), 100 (U), 101 (U), 102 (U), 103
15 (U), 104 (U), 105 (U), 106 (U), 107 (U), 108 (U), 109 (U), 110 (U), 111 (U), 112 (U), 113 (U), 114
(U), 115 (U), 116 (U), 117 (U), 118 (U), 119 (U), 120 (U), 121 (U), 122 (U), 123 (U), 124 (U), 125
(U), 126 (U), 127 (U), 128 (U), 129 (U), 130 (U), 131 (U), 132 (U), 133 (U), 134 (U), 135 (U), 136
(U), 137 (U), 138 (U), 139 (U), 140 (U), 141 (U), 142 (U), 143 (U), 144 (U), 145 (U), 146 (U), 147
(U), 148 (U), 149 (U), 150 (U), 151 (U), 152 (U), 153 (U), 154 (Z), 155 (Z), 156 (Z), 157 (Z), 158
20 (Z), 159 (Z), 160 (Z), 161 (Z), 162 (Z), 163 (Z), 164 (Z), 165 (Z), 166 (Z), 167 (Z), 168 (Z), 169
(Z), 170 (Z), 171 (Z), 172 (Z), 173 (Z), 174 (Z), 175 (Z), 176 (Z), 177 (Z), 178 (Z), 179 (Z), 180
(Z), 181 (Z), 182 (Z), 183 (Z), 184 (Z), 185 (Z), 186 (Z), 187 (Z), 188 (Z), 189 (Z), 190 (Z), 191
(Z), 192 (Z), 193 (Z), 194 (Z), 195 (Z), 196 (Z), 197 (Z), 198 (Z), 199 (Z), 200 (Z), 201 (Z), 202
(Z), 203 (Z), 204 (Z), 205 (Z), 206 (Z), 207 (Z), 208 (U), 209 (Z), 210 (U), 211 (Z), 212 (Z), 213
(Z), 214 (Z), 215 (Z), 216 (Z), 217 (Z), 218 (Z), 219 (U), 220 (U), 221 (U), 222 (U), 223 (U), 224
25 (U), 225 (U), 226 (U), 227 (U), 228 (U), 229 (U), 230 (U), 231 (Z), 232 (Z), 233 (Z), 234 (Z), 235
(Z), 236 (Z), 237 (Z), 238 (Z), 239 (Z), 240 (Z), 241 (Z), 242 (U), 243 (Z), 244 (Z), 245 (Z), 246
(U), 247 (Z), 248 (Z), 249 (Z), 250 (Z), 251 (Z), 252 (Z), 253 (Z), 254 (Z), 255 (Z), 256 (Z), 257
(Z), 258 (Z), 259 (Z), 260 (Z), 261 (Z), 262 (U), 263 (U), 264 (U), 265 (U), 266 (Z), 267 (Z), 268
(Z), 269 (Z), 270 (Z), 271 (Z), 272 (Z), 273 (Z), 274 (Z), 275 (Z), 276 (Z), 277 (Z), 278 (Z), 279
30 (Z), 280 (Z), 281 (Z), 282 (Z), 283 (Z), 284 (Z), 285 (Z), 286 (Z), 287 (Z), 288 (Z), 289 (U), 290
(U), 291 (U), 292 (U), 293 (U), 294 (U), 295 (U), 296 (Z), 297 (Z), 298 (Z), 299 (Z), 300 (Z), 301
(Z), 302 (U), 303 (U), 304 (U), 305 (U), 306 (Z), 307 (Z), 308 (Z), 309 (Z), 310 (Z), 311 (Z), 312
(Z), 313 (Z), 314 (Z), 315 (U), 316 (U), 317 (Z), 318 (Z), 319 (Z), 320 (Z), 321 (Z), 322 (Z), 323
(Z), 324 (Z), 325 (Z), 326 (Z), 327 (Z), 328 (Z), 329 (Z), 330 (Z), 331 (Z), 332 (Z), 333 (Z), 334
35 (Z), 335 (Z), 336 (Z), 337 (Z), 338 (Z), 339 (Z), 340 (Z), 341 (Z), 342 (Z), 343 (Z), 344 (Z), 345
(Z), 346 (Z), 347 (Z), 348 (Z), 349 (Z), 350 (Z), 351 (Z), 352 (Z), 353 (Z), 354 (Z), 355 (Z), 356
(Z), 357 (Z), 358 (Z), 359 (Z), 360 (Z), 361 (Z), 362 (Z), 363 (Z), 364 (Z), 365 (Z), 366 (Z), 367
(Z), 368 (Z), 369 (Z), 370 (Z), 371 (U), 372 (U), 373 (U), 374 (Z), 375 (Z), 376 (Z), 377 (Z), 378
(Z), 379 (E),

Ejemplo A

Prueba de *Phytophthora* (tomate) / preventivo

Disolvente: 49 partes en peso de N, N-dimetilformamida

5 Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril-polglicoléter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

10

Para ensayar la actividad preventiva, se pulverizan las plántulas con la preparación de compuesto activo a la relación de aplicación indicada. Un día después de este tratamiento, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Phytophthora infestans*. Las plantas permanecen durante un día en una cabina de incubación a aproximadamente 22°C y a una

15

humedad atmosférica relativa de 100%. Luego las plantas se colocan en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y a una humedad atmosférica relativa de 96%.

Se evaluó el ensayo 7 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observa enfermedad.

20

En este ensayo, los siguientes ejemplos de la tabla 1 de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de 70% o incluso mayor a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo:

Ejemplos Número 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 75, 76, 78, 80, 83, 84, 90, 91, 92, 93, 94, 96, 98, 99, 100, 102, 103, 104, 105, 106, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 129, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 146, 148, 149, 151, 160, 165, 175, 176, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 375, 376 y 377.

30

Ejemplo B

Ensayo de *Plasmopara* (viñedos) / protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona

35

24,5 partes en peso de dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilo poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora, se pulverizan las plántulas con la preparación de compuesto activo a la relación de aplicación indicada. Después de que se ha secado el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Plasmopara viticola* y a continuación se dejan durante 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y a una humedad atmosférica relativa de 100%. La planta se dispone posteriormente durante 4 días en un invernadero a aproximadamente 21°C y a una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 90%. Después, las plantas se vaporizan y se disponen durante un día en una cabina de incubación.

El ensayo se evalúa 6 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo, los siguientes ejemplos de la tabla 1 de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de 70% o incluso mayor a una concentración de 10 ppm de ingrediente activo:

Ejemplos Número 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 17, 18, 19, 20, 23, 24, 27, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 67, 70, 71, 76, 80, 82, 84, 114, 115, 116, 135, 160, 202, 205, 206, 207, 208, 209, 212, 213, 214, 216, 218, 220, 221, 223, 226, 230, 233, 234, 237, 238, 376 y 377.

Ejemplo C

Ensayo in vitro para el cálculo del valor DE50 con *Pythium aphanidermatum*

Los pocillos de placas de microtitulación de 96 huecos se rellenan con 10 µl de una solución del compuesto de ensayo en metanol junto con el emulsionante alquilaril poliglicol éter. Después de esto, el disolvente se evapora en una campana. En la siguiente etapa, a cada pocillo se le añaden 200 µl de medio líquido de dextrosa de patata que se ha complementado con una concentración apropiada de suspensión de esporas o micelio del hongo de ensayo.

Las concentraciones resultantes de los compuestos de ensayo en el pocillo de microtitulación son 50, 5, 0,5 y 0,05 ppm. La concentración resultante del emulsionante en todos los pocillos es constantemente de 300 ppm.

Con la ayuda de un fotómetro, se mide la extinción a la longitud de onda de 620 nm.

Después, las placas de microtitulación se transfieren durante 3-5 días a un agitador a 20°C con una humedad relativa de 85%.

5

Al final del tiempo de incubación, se mide de nuevo el crecimiento de los organismos de ensayo fotométricamente a la longitud de onda de 620 nm. La diferencia entre los dos valores de extinción (tomados antes y después de la incubación) es proporcional al crecimiento del organismo de ensayo.

10 Basándose en el Δ de los datos de extinción de las diferentes concentraciones de ensayo y del organismo de ensayo no tratado (control) se calcula una curva de respuesta a la dosis. La concentración que es necesaria para dar una inhibición del crecimiento de 50% se define y se indica como valor DE50 (= Dosis Eficaz que provoca una inhibición del crecimiento de 50%) en ppm (= mg / l).

15

En este ensayo, los ejemplos siguientes de la tabla 1 según la invención mostraban un valor ED50 menor que 1 ppm: Ejemplos Número 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 28, 29, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 69, 71, 73, 77, 78, 80, 81, 82, 83, 84, 86, 87, 89, 91, 92, 93, 97, 99, 101, 103, 106, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 129, 130, 131, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 145, 146, 148, 149, 150, 151, 160, 164, 165, 171, 175, 176, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 221, 224, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 375, 376 y 377.

25 Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitante la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención.

Preparación de N-{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}hex-5-inamida (Compuesto 34) según el procedimiento P2

30 *Etapa 1: Preparación de 2-{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}-1H-isoindol-1,3(2H)-diona*

A una disolución de N-hidroxi-1-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-1-fenilmetanimina (21,5g, 0,106 mol) en acetonitrilo (638 mL) se añadió carbonato de cesio (72,4g, 0,222 mol), yoduro de potasio (1,76g, 0,011 mol) y a continuación 2-[6-(bromometil)piridin-2-il]-1H-isoindol-1,3(2H)-

35

diona (35,23g, 0,111 mol), la suspensión blanca se agitó a temperatura ambiente durante cuatro horas. Se añade agua (700 ml), se separa el precipitado por filtración y se lava con agua hasta decoloración, a continuación se seca a vacío toda la noche para proporcionar 2-{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}-1H-isoindol-1,3(2H)-diona [40,0 g; 86% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 440 (M+H); logP(HCOOH) = 3,04].

Etapa 2: Preparación de 6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-amina

A una disolución de 2-{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}-1H-isoindol-1,3(2H)-diona (119g, 0,271 mol) en tetrahidrofurano (2610 mL) se añade hidrato de hidrazina (66,26mL, 1,354 mol), se agita la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante seis horas. El precipitado que se forma se separa por filtración y se lava con tetrahidrofurano, a continuación se concentra el filtrado a vacío para producir un sólido blanco roto que se purifica adicionalmente mediante trituración en diclorometano para proporcionar 6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-amina [83,0 g ; 94% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 310 (M+H); logP(HCOOH) = 1,14].

Etapa 3: Preparación de N-{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}hex-5-inamida

A una disolución de 6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-amina (251 mg, 0,81mmol) en diclorometano (10mL) se añade trietilamina (0,22 mL, 1,62 mmol), cloruro de hex-5-inoilo (211 mg, 1,62 mmol). La mezcla de reacción se agita durante 5 horas a temperatura ambiente, se concentra a vacío y a continuación se purifica mediante cromatografía de gel de sílice para proporcionar N-{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}hex-5-inamida [200 mg; 95% de pureza ; 58% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 404 (M+H); logP(HCOOH) = 2,98].

30

35

Preparación de 6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de 4-clorobutilo (Compuesto 67) según el procedimiento P3

Etapa 1: Preparación de 2-(6-[[[(1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)oxi]metil]piridin-2-il]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona

Una suspensión de N-hidroxiftalimida (35,0g, 214 mmol), 2-[6-(bromometil)piridin-2-il]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona (74,8 g, 236 mmol), carbonato de cesio (146,8 g, 450 mmol) y yoduro de potasio (1,78g, 10,7 mmol) en acetonitrilo (350 mL) se agita a temperatura ambiente durante 18h. Se añade agua (300 mL), el precipitado se separa por filtración y se lava hasta decoloración, a continuación se seca a vacío toda la noche para proporcionar 2-(6-[[[(1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)oxi]metil]piridin-2-il]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona como un sólido sin color [85,0 g ; 94% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 400 (M+H); logP(HCOOH) = 2,44].

Etapa 2: Preparación de 6-[(aminooxi)metil]piridin-2-amina

A una disolución de 2-(6-[[[(1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)oxi]metil]piridin-2-il]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona (50g, 125 mmol) en THF (350 mL) se añade gota a gota hidrato de hidrazina (61 mL, 1,25 mol) a temperatura ambiente. Después de agitar toda la noche a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtra y el filtrado se concentra a sequedad a vacío. La purificación del residuo sobre gel de sílice proporcionó 6-[(aminooxi)metil]piridin-2-amina como un aceite sin color [10,0 g ; 57% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 140 (M+H); logP(HCOOH) < -0,23].

Etapa 3: Preparación de 6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-amina mediante condensación de 6-[(aminooxi)metil]piridin-2-amina con 1-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-1-fenilmetanimina

Bajo gas protector (argón), se sella un tubo de reacción que contiene una disolución de (1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metanona (188 mg; 1,0 mmol), 6-[(aminooxi)metil]piridin-2-amina (139 mg ; 1,0 mmol) y monohidrato ácido p-toluensulfónico (190 mg; 1,0 mmol) en 2-propanol (2 mL) y se calienta en un horno microondas a 160°C durante 90 min. Para trabajar, se deja que la mezcla se enfríe, se diluye con diclorometano (10 mL) y se lava dos veces con 3 ml cada vez de disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La fase acuosa se extrae con diclorometano y las capas orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio y se concentran a presión reducida. La purificación sobre gel de sílice proporciona 6-

[{[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)metil]piridin-2-amina como un aceite sin color [205 mg ; 66% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 310 (M+H); logP_(HCOOH) = 1,13].

5 *Etapla 4: Preparación de 6-[[{[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)metil]piridin-2-il]carbamato de 4-clorobutilo (Compuesto 67)*

A una disolución agitada de 6-[[{[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)-metil]piridin-2-amina (150 mg, 0,485 mmol) en diclorometano (5 mL), se añade piridina (0,078mL), carbonohidrocloreuro de 4-clorobutilo (166mg, 0,970mmol) .La mezcla de reacción
10 se agita durante 5 horas a temperatura ambiente, se concentra a vacío y a continuación se purifica mediante cromatografía sobre gel de sílice para proporcionar 6-[[{[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)metil]piridin-2-il]carbamato de 4-clorobutilo [200 mg; 90% de pureza ; 84% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 344 (M+H); logP_(HCOOH) = 3,67].

15 **Preparación de 4-[(aminooxi)metil]-1,3-tiazol-2-amina**

Etapla 1: Preparación de 2-[(2-amino-1,3-tiazol-4-il)metoxi]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona

Una suspensión de N-hidroxiftalimida (50,0g, 306 mmol), 4-(clorometil)-1,3-tiazol-2-amina (50,1 g, 337 mmol), carbonato de cesio (210 g, 0,64 mol) y ioduro de potasio (2,54g,
20 15,3 mmol) en acetonitrilo (440 mL) se agita a temperatura ambiente durante 18h. Se añade agua (300 mL), se separa el precipitado por filtración y se lava con agua hasta decoloración, a continuación se seca a vacío toda la noche para proporcionar 2-[(2-amino-1,3-tiazol-4-il)metoxi]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona como un sólido sin color [36,0 g ; 43% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 276 (M+H); logP(HCOOH) = 0,74].

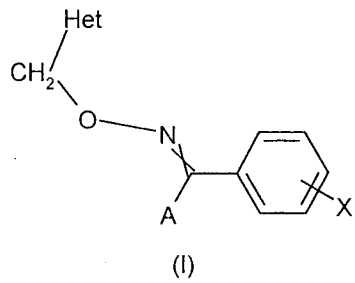
25

Etapla 2: 4-[(aminooxi)metil]-2-bromo-1,3-tiazol

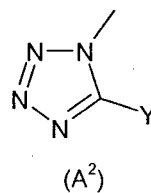
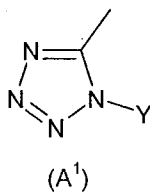
A una disolución de 2-[(2-amino-1,3-tiazol-4-il)metoxi]-1H-isoindol-1,3(2H)-diona (10g, 36,3 mmol) en THF (100 mL) se añade gota a gota hidrato de hidrazina (9,1 g, 181 mmol) a
30 temperatura ambiente. Después de agitar toda la noche a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtra y el filtrado se concentra a sequedad a vacío. La purificación del residuo sobre gel de sílice proporcionó 4-[(aminooxi)metil]2-bromo-1,3-tiazol como un aceite sin color [5,2 g ; 99% de lo teórico ; HPLC/MS: m/z = 146 (M+H); logP(HCOOH) < -0,23].

REIVINDICACIONES

1 Un compuesto de fórmula (I)



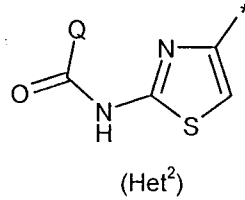
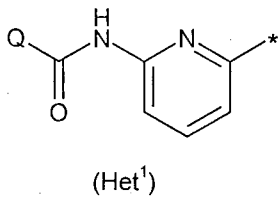
- 5
- X representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, un grupo ciano, un grupo metanosulfonilo, un grupo nitro, un grupo trifluorometilo o un grupo arilo ;
 - A representa un grupo tetrazoilo de fórmula (A¹) o (A²):



10

en donde Y representa alquilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir; y

- Het representa un grupo piridilo de fórmula (Het¹) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het²) ;



15

en la que

- Q representa a tri(alquilo-C₁-C₈)sililo-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, tri(alquilo C₁-C₈)sililo-cicloalquilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, aril-ciclopropilo sustituido o sin sustituir, halogenocicloalquilo C₃-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquenilo-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, C₂-C₈-sustituido o sin sustituir , alquinilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenoalcoxialquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1
- 20
- 25

a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alqueniloxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalqueniloxi-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquiniloxi-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, (alqueniloxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, (alquiniloxiimino-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, (benciloxiimino)-alquilo-C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, benciloxi sustituido, fenoxi sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; [arilo sustituido]-alquilo-[C₁-C₈]; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-halogenoalquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S y que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; tri(alquilo-C₁-C₈)-sililoxi sustituido o sin sustituir, bicicloalquilo-C₅-C₁₂ condensado sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo-C₅-C₁₂ condensado sustituido o sin sustituir, bicicloalquilo-C₅-C₁₂ condensado-alquilo-[C₁-C₈] sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo-C₅-C₁₂ condensado-alquilo-[C₁-C₈] sustituido o sin sustituir, arilcarbonilo sustituido o sin sustituir, alquilo-C₁-C₈-carbonilo sustituido o sin sustituir, heterociclilcarbonilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S;

así como sales, N-óxidos, complejos metálicos y complejos metaloides de los mismos o isómeros (E) y (Z) y mezclas de los mismos.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde X representa aun átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un alcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un grupo ciano, un grupo metanosulfonilo, un grupo nitro, un grupo trifluorometilo o un grupo arilo.

3. Un compuesto según la reivindicación 2, en donde X representa un átomo de cloro, un átomo de flúor, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un

grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo terc-butilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi, un grupo isopropoxi o un átomo de hidrógeno.

4 Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 3, en el que Y representa un grupo
5 metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo o un grupo isopropilo.

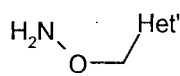
5. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 4, en donde Q representa un
cicloalquil-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈ sustituido o sin
sustituir, alquínilo-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir
10 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxialquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir
que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alquénilo-C₂-C₈
sustituido o sin sustituir, halogenoalquénilo-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5
átomos de halógeno, alquínilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquínilo-C₃-C₈
sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi sustituido,
15 fenoxi sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin
sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista
que consiste en N, O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin
sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista
que consiste en N, O, S; heterociclilo-halogenoalquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros,
20 saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que
consiste en N, O, S y que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; bicicloalquilo condensado-C₅-
C₁₂ sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo condensado C₅-C₁₂ sustituido o sin sustituir.

6. Un compuesto según la reivindicación 5, en donde Q representa un cicloalquilo-C₃-C₈-
25 alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, cicloalquenilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, alquínilo-C₂-
C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5
átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alquénilo-C₂-C₈ sustituido o sin
sustituir, alquínilo-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalquínilo-C₃-C₈ sustituido o sin
sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi sustituido, fenoxi sustituido o sin
30 sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado
o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N,
O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o
insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N,
O, S.

7. Un compuesto según la reivindicación 6, en donde Q representa un cicloalquilo-C₃-C₈-alquilo-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, alquino-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi-C₁-C₈ sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alqueno-C₂-C₈ sustituido o sin sustituir, alquino-C₃-C₈ sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; heterociclilo-alquilo-[C₁-C₈] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S.

10

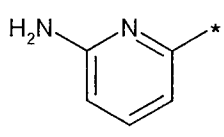
8. Un compuesto de fórmula (VI):



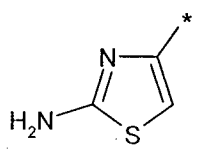
(VI)

15

o una de sus sales, en donde Het' representa un grupo piridilo de fórmula (Het' ¹) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het' ²):



(Het' ¹)



(Het' ²)

20

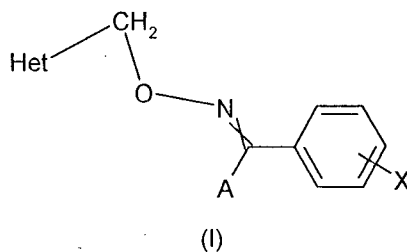
9. Una composición fungicida que comprende, como un ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 7 y un soporte, carga o vehículo aceptable desde un punto de vista agrícola.

25

10. Un método para controlar los hongos fitopatógenos de los cultivos, caracterizado por que se aplica una cantidad eficaz desde un punto de vista agrícola y sustancialmente no fitotóxica de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 7 o una composición según la reivindicación 9 al suelo en el que las plantas crecen o son capaces de crecer, a las hojas y/o al fruto de las plantas o a las semillas de las plantas.

RESUMEN

La presente invención se refiere a derivados de hidroximoi-tetrazol de fórmula (I), a su procedimiento de preparación, a su uso como agentes activos fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas y a métodos para luchar contra hongos fitopatógenos, especialmente de plantas, usando estos compuestos o composiciones.



en donde A representa un grupo tetrazolilo, Het representa un grupo piridilo o un grupo tiazolilo y X representa distintos sustituyentes.

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO****DIVISION DE NUEVAS CREACIONES****TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS**SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION PCT **X** MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud: 27/01/2011

(51) Clasificación Internacional :

(71) Solicitante(s): BAYER CROPS SCIENCE AG

(72) Inventor(es): BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; BERNIER, David; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DESBORDES, Philippe; DUBOST, Christophe; GENIX, Pierre; PORTZ, Daniela; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike.

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad

(31) **No. Prioridad** 32)**Fecha**(33) **País**

08356101.9

04/07/2008

EP

(85) Fecha inicio fase nacional: 04/02/2011

(87) Publicación internacional

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

Fecha: 07/01/2010

Fecha de presentación de la solicitud: 03/07/2009

N° publicación: WO2010/000841

No. de solicitud: PCT/EP2009/058427

(54) Título: Derivados de hidroximoiil-tetrazol fungicidas



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION PCT X MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud: 27/01/2011

(51) Clasificación Internacional: C07D 401/12 (2006.01); A01N 43/78 (2006.01); A01N 43/713 (2006.01)

(71) Solicitante(s): BAYER CROPSCIENCE AG

(72) Inventor(es): BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; BERNIER, David; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DESBORDES, Philippe; DUBOST, Christophe; GENIX, Pierre; PORTZ, Daniela; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike.

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	32) Fecha	(33) País
	08356101.9	04/07/2008	EP

(85) Fecha límite inicio fase nacional: 04/01/2011

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

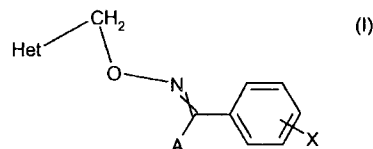
Fecha de presentación de la solicitud: 03/07/2009

No. de solicitud: PCT/EP2009/058427

(87) Publicación internacional:

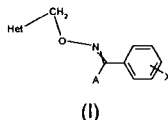
Fecha: 07/01/2010

No. Publicación: WO2010/000841



(54) Título: Derivados de hidroximoi-tetrazol fungicidas

(57) Resumen: La presente invención se refiere a derivados de hidroximoi-tetrazol de fórmula (I), a su procedimiento de preparación, a su uso como agentes activos fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas y a métodos para luchar contra hongos fitopatógenos, especialmente de plantas, usando estos compuestos o composiciones.



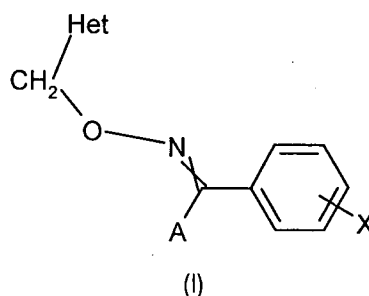
en donde A representa un grupo tetrazolilo, Het representa un grupo piridilo o un grupo tiazolilo y X representa distintos sustituyentes.

CONTINUA AL RESPALDO ...

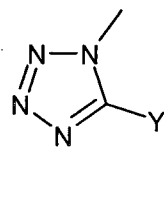
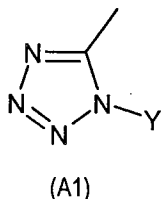
(21) N° de solicitud:	(51) Int Cl: C07D 401/12 (2006.01); A01N 43/78 (2006.01); A01N 43/713 (2006.01)
22) Fecha de solicitud: 27/01/2011	(71) Solicitante(s): BAYER CROPSCIENCE AG
(30) Prioridad (31) No. Prioridad 32) Fecha (33) País 08356101.9 04/07/2008 EP	(72) Inventor(es): BEIER, Christian; BENTING, Jürgen; BERNIER, David; CHRISTIAN, Isabelle; COQUERON, Pierre-Yves; DESBORDES, Philippe; DUBOST, Christophe; GENIX, Pierre; PORTZ, Daniela; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike. (74) Apoderado: Alvaro Correa Ordóñez
(54) Título: Derivados de hidroximoil-tetrazol fungicidas	

Reivindicación(es):

1 Un compuesto de fórmula (I)

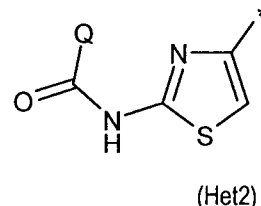
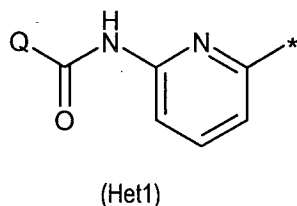


- X representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C1-C8, alcoxi C1-C8, un grupo ciano, un grupo metanosulfonilo, un grupo nitro, un grupo trifluorometilo o un grupo arilo ;
- A representa un grupo tetrazoilo de fórmula (A1) o (A2):



en donde Y representa alquilo C1-C8 sustituido o sin sustituir; y

- Het representa un grupo piridilo de fórmula (Het1) o un grupo tiazolilo de fórmula (Het2) ;



en la que

- Q representa a tri(alquilo-C1-C8)sililo-alquilo-C1-C8 sustituido o sin sustituir, tri(alquilo C1-C8)sililo-cicloalquilo-C3-C8 sustituido o sin sustituir, aril-ciclopropilo sustituido o sin sustituir, halogenocicloalquilo C3-C8 sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo-C3-C8-alquilo-C1-C8 sustituido o sin sustituir, cicloalqueno-C3-C8 sustituido o sin sustituir, cicloalqueno-C3-C8-alquilo-C1-C8 sustituido o sin sustituir, halogenoalqueno-C2-C8 sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, C2-C8-sustituido o sin sustituir , alquino-C1-C8 sustituido o sin sustituir, halogenoalcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, halogenoalcoxialquilo-C1-C8

sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenoxialquilo sustituido o sin sustituir, alqueniloxi-C2-C8 sustituido o sin sustituir, halogenoalqueniloxi-C2-C8 sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi-C3-C8 sustituido o sin sustituir, halogenoalquiniloxi-C3-C8 sustituido o sin sustituir que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino-C1-C6)-alquilo-C1-C6 sustituido o sin sustituir, (alqueniloxiimino-C1-C6)-alquilo-C1-C6 sustituido o sin sustituir, (alquiniloxiimino-C1-C6)-alquilo-C1-C6 sustituido o sin sustituir, (benciloxiimino)-alquilo-C1-C6 sustituido o sin sustituir, benciloxi sustituido, fenoxi sustituido o sin sustituir, arilo sustituido, heterociclilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; [arilo sustituido]-alquilo-[C1-C8]; heterociclilo-alquilo-[C1-C8] de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S ; heterociclilo-halogenoalquilo-[C1-C8] de 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S y que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; tri(alquilo-C1-C8)-sililoxi sustituido o sin sustituir, bicicloalquilo-C5-C12 condensado sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo-C5-C12 condensado sustituido o sin sustituir, bicicloalquilo-C5-C12 condensado-alquilo-[C1-C8] sustituido o sin sustituir, bicicloalquenilo-C5-C12 condensado-alquilo-[C1-C8] sustituido o sin sustituir, arilcarbonilo sustituido o sin sustituir, alquilo-C1-C8-carbonilo sustituido o sin sustituir, heterociclilcarbonilo de 4, 5, 6 o 7 miembros sustituido o sin sustituir, saturado o insaturado que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S; así como sales, N-óxidos, complejos metálicos y complejos metaloides de los mismos o isómeros (E) y (Z) y mezclas de los mismos.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-009281-00000-0000

Fecha: 2011-01-27 17:17:34

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 411 PRESENTACION

Folios: 103

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO DE UTILIDAD ☐

- ☐ Indicación que se solicita una patente.
- ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
- ☐ Descripción de la invención
- ☐ Dibujos de ser estos pertinentes
- ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
- Completa ☐ Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

- ☒ Indicación que se solicita una PCT
- ☒ Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
- ☒ Dibujos de ser estos pertinentes
- ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
- Completa ☒ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

- ☐ Indicación que se solicita Diseño industrial
- ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
- ☐ Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
- ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas
- Completa ☐ Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

- ☐ Indicación que se solicita un esquema de trazado
- ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
- ☐ Representación gráfica de un esquema de trazado
- ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas
- Completa ☐ Incompleta ☐



Bogotá D.C.,
2020

Doctor(a)
CORREA ORDOÑEZ ALVARO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPS SCIENCE AG.

REFERENCIA	Radicación No.	11 009281
	Solicitud internacional	PCT/EP2009/058427
	Fecha inicio fase nacional	04/02/2011
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	

05469

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

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

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

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

JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

25 MAR. 2011

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha _____
adpa11