



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

04-86402

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO

DIFLUORMETILTIAZOLILCARBOXANILIDAS

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

Monheim, República Federal de Alemania.

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

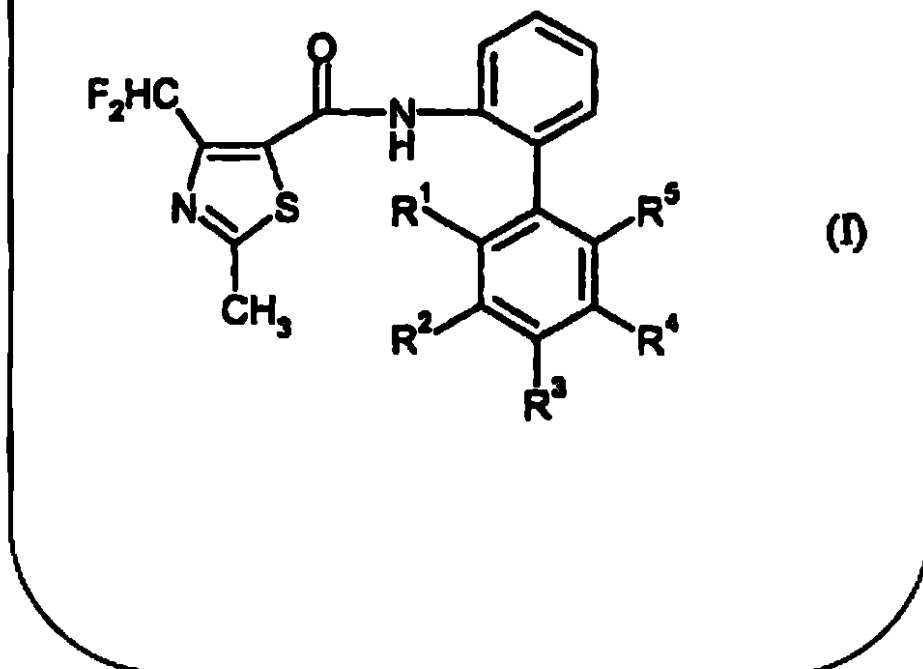
C.C. No. 438.919 de Usaquén

22. BOGOTA, D.C.,

	7. Martin KUGLER Am Kloster 47, D-42789 Leichlingen, República Federal de Alemania	8. Thomas JAETSCH Innere Kanalstr. 220, D-50670 Köln, República Federal de Alemania						
	9. Peter WACHTLER Doerperhofstr. 35, D-47800 Krefeld, República Federal de Alemania							
5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP03/00589</u> Fecha: <u>22 de enero de 2003</u> Publicación Internacional No. <u>WO 03/066510 A1</u> Fecha: <u>14 de agosto de 2003</u>							
6	Título (54) DIFLÚORMETILTIAZOLILCARBOXANILIDAS							
7	Clasificación Internacional (51) <u>G07D 277/58, A01N 43/78</u>							
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	<table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="560 1008 868 1061">(33) País de Origen</th> <th data-bbox="868 1008 1226 1061">(32) Fecha</th> <th data-bbox="1226 1008 1550 1061">(31) Número de Solicitud</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="560 1061 868 1182"><u>DE</u></td> <td data-bbox="868 1061 1226 1182"><u>04 de febrero de 2002</u></td> <td data-bbox="1226 1061 1550 1182"><u>102 04 391.4</u></td> </tr> </tbody> </table>	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud	<u>DE</u>	<u>04 de febrero de 2002</u>	<u>102 04 391.4</u>
(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud						
<u>DE</u>	<u>04 de febrero de 2002</u>	<u>102 04 391.4</u>						
9	Comprobante de pago No.: <u>04 - 63.241</u> Fecha: <u>30 de agosto de 2004</u>							
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por 5 422.000,00. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita 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. De acuerdo con la Regla 4 del PCT con relación a la autorización de la compañía solicitante a solicitar y obtener una patente por la relación laboral con los inventores y un acuerdo entre el solicitante original y el solicitante de la solicitud internacional del 24 de Octubre de 2002 y la autorización del solicitante de reivindicar la prioridad de una solicitud de patente anterior por un acuerdo entre el solicitante original y el solicitante de la solicitud internacional del 08 de noviembre de 2002. ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☒ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredita 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 12x12 ☐ 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. ☐ Otros							

11

FIGURA CARACTERISTICA:



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

DLM



Representación y Poder con autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of-Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF-ATTORNEY

Yo (nosotros), abajo firmado (a)/I (we), the undersigned
Bayer CropScience AG

domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,

40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application

No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombro a EMILIO FERRERO, ipa. 31929; GONZALO PERDOMO, ipa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, ipa. 23555 y GERMAN CAVELIER, ipa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, al primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Consul de Colombia, en el extranjero; y si su intenció de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrá ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, reuniéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (confiramos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (autorizamos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualquier autoridad o personas, ejercer o no jurisdicción, especialmente ante las del orden

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, ipa. 31929; GONZALO PERDOMO, ipa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, ipa. 23555 and GERMAN CAVELIER, ipa. 832, domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third alternate replaces the first or second alternate in their turn, or both of them, jointly. In such cases, the principal, first alternate, or the first or second alternates in their turn, or both of them, jointly, shall state their intention not to appear or represent through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternates shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact of its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternate in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above named attorneys at law so that they may 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.

5

strative, contentious administrative and judicial, as well as before
Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents of invention, models of utility, and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain names, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or judicial, nullity, measures cautelares, granting of licenses, the tutela, the protection of secrets industrial, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, deny, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

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 and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain names, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or judicial, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, deny, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Dado y firmado hoy/Given and signed this 12th of February, 2003
en/in Leverkusen
por/by Dr. Axel Bader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

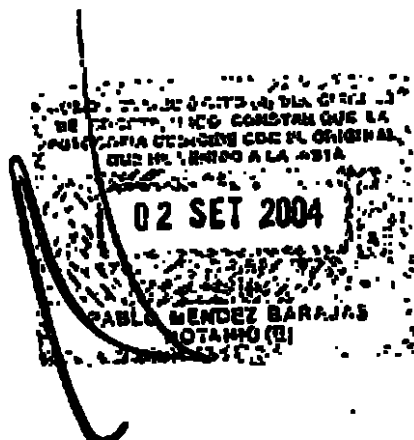
Firma

Signature

Bayer CropScience AG

Dr. Bader

Dr. Jesse



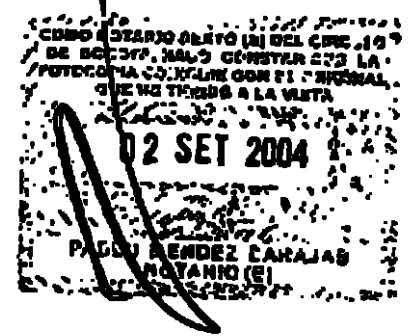
NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

El Notario Público Certifica: Que la firma que antecede de
Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jasse
auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo
de Secretarios
de la compañía Bayer CropScience AG
sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a
las leyes de Alemania
que la dirección de dicha compañía es Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Alemania
y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.
Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los
documentos respectivos y de todo ello da fe.
Dado y firmado en Leverkusen
El 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature
of
Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jasse
is authentic, that the signatory currently acts in the position of
secretaries
of the company Bayer CropScience AG
a company currently existing and organized under the laws of
Germany
that the address is Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Germany
and that the signatory has the power to grant this document.
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
examination of the corresponding documents.
Given and signed in Leverkusen
On 12th of February, 2003

[Signature]
El Notario Público The Notary Public
(Firma-sello) (Signature-seal)



7
URNr. 242/2003

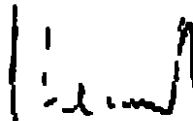
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

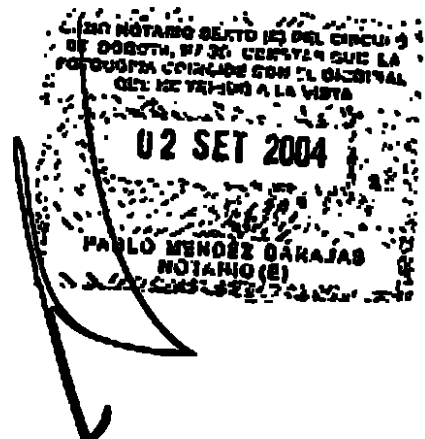
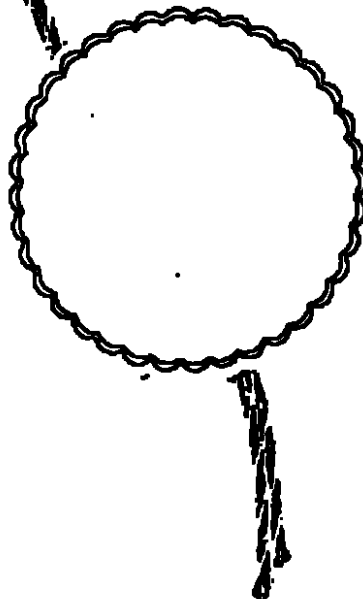
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht in das Handelsregister des
Amtsgerichts Langenfeld - HRB 3990 -, daß die genannten Herren
berechtigt sind, die Bayer CropScience Aktiengesellschaft in
Monheim am Rhein als Prokuristen einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 12. Februar 2003


Notar



APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde

2. ist unterschrieben von _____
Dirk Heiderhoff

3. in seiner Eigenschaft als Notar _____

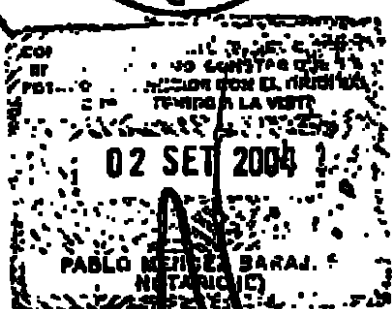
4. sie ist versehen mit dem Stempel/Siegel des (des) _____
Notars Dirk Heiderhoff
in Leverkusen

5. in Köln
Beitrag: 99. FEB 2003
6. am _____

7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482103

9. Stempel/Siegel: _____ 10. Unterschrift: Lavin Calaba

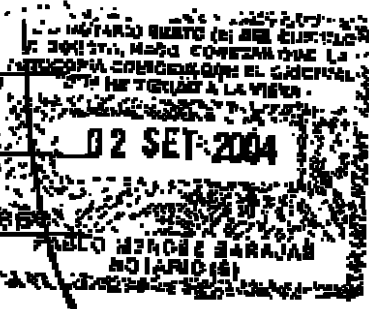


669 150 10.-
10.-
13.-
528
22,28

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 10.09/02 realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia y registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28 de enero de 2003 y otorga derechos de representación y poder a los Doctores EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, tpa. 23555 y GERMÁN CAVELIER, tpa. 632, domiciliados en la Carrera 4= No. 72-35.

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003
en Leverkusen
por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse



Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible

(ANEXO)

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (SOCIEDAD) en donde se certifican la firma anterior del Doctor Axel Bader y del Doctor Ralf-Rüdiger Jesse como

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS Z.
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLÉS - INGLÉS - ESPAÑOL
DES 01/01 DE 2000 A 31 DE 2004

Secretarios de Bayer CropScience AG, una sociedad actualmente existente y organizada de acuerdo a las leyes de Alemania y con dirección en Alfred-Nobel-Str. 50, 40769 Monheim, Alemania. Dado y firmado en Leverkusen el 12 de febrero del 2003.

Firma Ilegible

Notario Público

Sello

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

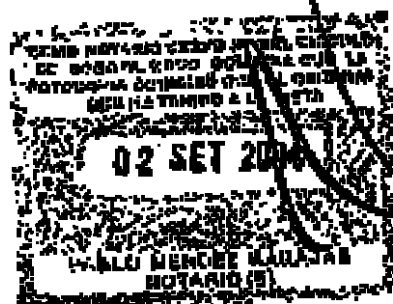
Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el 17 de febrero de 2003 bajo el número 482/03.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

DVZ/ID-426B/WPCL002G/COLO 13545-841-002-0

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS
TRADUCTOR E INTERPRETE ORCIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA



ROSE ARRIETA
REGISTRADORA DEL ESTADO

2003 MAR 18 P 12:24

LEFE DE LA FOLIA DE LA
CIGARRA

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

2003 MAR 18 P 12:24

CUYA FIRMA APLAZA EN EL
DOCUMENTO DESEMPEN
LAS FUERZAS INDICADAS

62 SET 2004

PABLO NERVEN DARRIAS
NOTARIO

COMO NO. 4 VO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
SAGUNA, HAN CONSTAR QUE LAS ANTERIORES
AN(3) FUESE PUN

IDENTIFICADO CON C.A. No. (3)

SANTA FE DE AGOSTO 18 MAR 2003

85(SOM) AUTENTICA(3)



TRADUCCION OFICIAL No. 9430

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber, resolución del Ministerio de Justicia 599 del 6 de marzo 1978.-

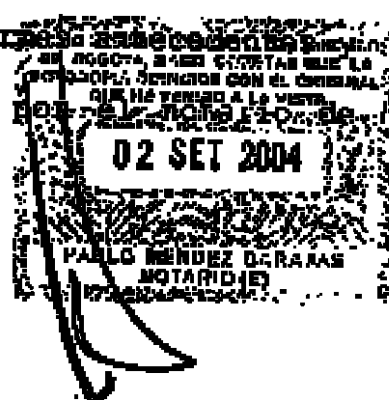
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23535 y GERMAN CAVEZIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. Dado y firmado el 12 de febrero 2003 en Leverkusen, Alemania, por los señores Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse.

Autenticación en español e inglés de las firmas anexas a la certificación de existencia de la sociedad Bayer CropScience AG, Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen.



02 DE FEBRERO DE 2003
Fdo.:
Notario

Protocolo notarial 242/2003

Certifico la autenticidad de la firma antecedentes puestas
ante mí por los señores

1. Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, con domicilio comercial en D-
51368, Bayerwerk, Alemania,
2. Dr. Axel Bader, con domicilio comercial en D-51369,
Bayerwerk, Alemania,

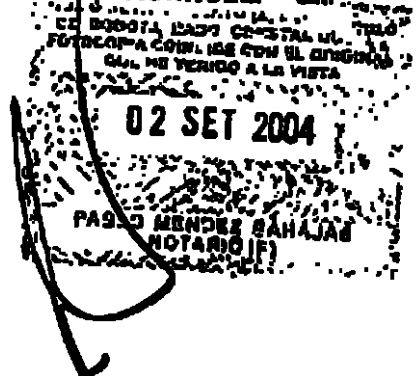
a quienes conozco en persona.

Certifico, por haber tenido la lista el registro de comercio
del Juzgado Municipal de Langenfeld -HRB 3990- que los
mencionados señores están facultados, en su calidad de
apoderados, para representar individualmente a la firma Bayer
CropScience Aktiengesellschaft, domiciliada en Monheim am
Rhein.

Leverkusen, 12 de febrero 2003

(Hilo y oblea notarial)

Fdo.: firma ilegible, Notario



Costas

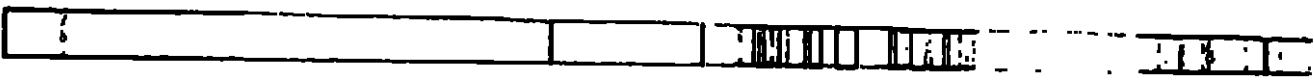
Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-

[Handwritten signature]



MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993

2011
TODA FIRMA APORTE EN EL
DOCUMENTO DESEMPLEA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

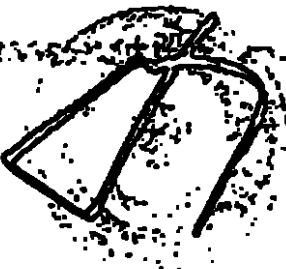
20 MAR 18 P 12:24

15-1-2011
BROUHAUX

QUINTA NOTARIA SEXTO DE: NOTARIO DE SANTAFÉ DE
BOGOTÁ, COLOMBIA, DE LAS FIRMAS DE:
[Firma]
[Firma]
[Firma]

COLOMBIA, BOGOTÁ, D.C.

18 MAR 2011



QUINTA NOTARIA SEXTO DE: NOTARIO DE SANTAFÉ DE
BOGOTÁ, COLOMBIA, DE LAS FIRMAS DE:
[Firma]
[Firma]
[Firma]
02 SET 2011

PCT-ANTRAG

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 07.01.2003 10:32:29 AM

LEA35857-WO

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Aktenzeichen	
0-2	Internationales Anmeldedatum	
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
0-4	Formular - PCT/RO/191 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.92 (aktualisiert 01.10.2002)
0-5	Antragsvorsuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patenschutzes behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LEA35857-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	DIFLUORMETHYLTHIAZOLYL CARBOXANILIDE
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
II-5	Anschrift:	Alfred-Nobel-Str. 50 D-40789 Monheim Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-1	Anmelder und/oder Erfinder	
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-1-2	Anmelder für	Nur US
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ELBE, Hans-Ludwig
III-1-5	Anschrift:	Dasnöckel 59 D-42329 Wuppertal Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

II-2	Anmelder und/oder Erfinder	
II-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
II-2-2	Anmelder für	Nur US
II-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	RIECK, Heiko
II-2-5	Anschrift:	9, rue Claude Monet F-69110 Ste. Foy-lès-Lyon Frankreich
II-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-2-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	FR
III-3	Anmelder und/oder Erfinder	
III-3-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-3-2	Anmelder für	Nur US
III-3-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DUNKEL, Ralf
III-3-5	Anschrift:	Krischenstr. 22 D-40789 Monheim Deutschland
III-3-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-3-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-4	Anmelder und/oder Erfinder	
III-4-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-4-2	Anmelder für	Nur US
III-4-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike
III-4-5	Anschrift:	Oberer Markenweg 85 D-56566 Neuwied Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-4-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-5	Anmelder und/oder Erfinder	
III-5-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-5-2	Anmelder für	Nur US
III-5-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KUCK, Karl-Heinz
III-5-5	Anschrift:	Pastor-Löh-Str. 30 a D-40764 Langenfeld Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

II-6	Anmelder und/oder Erfinder	
II-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
II-6-2	Anmelder für	Nur US
II-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	MAULER-MACHNIK, Astrid
II-6-5	Anschrift:	Neuenkamper Weg 48 D-42799 Leichlingen Deutschland
II-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-7	Anmelder und/oder Erfinder	
II-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
II-7-2	Anmelder für	Nur US
II-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KUGLER, Martin
II-7-5	Anschrift:	Am Kloster 47 D-42799 Leichlingen Deutschland
II-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-8	Anmelder und/oder Erfinder	
II-8-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
II-8-2	Anmelder für	Nur US
II-8-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	JAETSCH, Thomas
II-8-5	Anschrift:	Innere Kanalstr. 220 Merlostr. 22 D-50670 Köln 50668 Köln Deutschland
II-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-8-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-9	Anmelder und/oder Erfinder	
II-9-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
II-9-2	Anmelder für	Nur US
II-9-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	WACHTLER, Peter
II-9-5	Anschrift:	Deerpferhofstr. 35 Scheiblersstr. 85 D-47800 Krefeld Deutschland
II-9-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-9-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

IV-1	Anwalt oder gemeinsamer Vertreter; oder besondere Zustellanschrift Die unten bezeichnete Person ist/wird hiermit bestellt, um den (die) Anmelder vor den internationalen Behörden zu vertreten, und zwar als:	gemeinsamer Vertreter
IV-1-1	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
IV-1-2	Anschrift:	Legal and Patents Patents and Licensing D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	0214 30 29033
IV-1-4	Telefaxnr.	0214 30 53482
V	Bestimmung von Staaten	
V-1	Regionales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AP: GH GM KE LS MW MZ SD SL SZ TZ UG ZM ZW und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat des Harare-Protokolls und Vertragsstaat des PCT ist. EA: AM AZ BY KG KZ MD RU TJ TM und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist EP: AT BE BG CH&LI CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR IE IT LU MC NL PT SE SK TR und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist OA: BF BJ CF CG CI CM GA GN GQ GW ML MR NE SN TD TG und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat der OAPI und Vertragsstaat des PCT ist
V-2	Nationales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AE AG AL AM AT AU AZ BA BB BG BR BY BZ CA CH&LI CN CO CR CU CZ DE DK DM DZ EC EE ES FI GB GD GE GH GM HR HU ID IL IN IS JP KE KG KP KR KZ LC LK LR LS LT LU LV MA MD MG MK MN MW MX ME NO NZ OM PH PL PT RO RU SC SD SE SG SI SK SL TJ TM TN TR TT TZ UA UG US UZ VC VN YU ZA ZM ZW
V-3	Nationales Patent (Staaten, die dem PCT nach Veröffentlichung dieser PCT-EASY-Version beigetreten sind.)	und alle weiteren Staaten, die am Anmeldetag dem PCT angehören.

V-3	Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen Zusätzlich zu den unter Punkten V-1, V-2 und V-3 vorgenommenen Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der nachstehend unter Punkt V-6 angegebenen Staaten. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt.		
V-6	Staaten, die von der Erklärung über vorsorgliche Bestimmungen ausgeschlossen werden	KEINE	
VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-1-1	Anmeldedatum	04 Februar 2002 (04.02.2002)	
VI-1-2	Nummer	10204391.4	
VI-1-3	Staat	DE	
VII-1	Gewählte internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VII	Erklärungen	Anzahl der Erklärungen	
VII-1	Erklärung hinsichtlich der Identität des Erfinders	-	
VII-2	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten	1	1
VII-3	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen	1	
VII-4	Erfindererklärung (nur im Hinblick auf die Bestimmung der Vereinigten Staaten von Amerika)	-	
VII-5	Erklärung hinsichtlich unschädlicher Offenbarungen oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit	-	

VIII-2-1	Erklärung: Berechtigung, ein Patent zu beantragen und zu erhalten Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regeln 4.17 Ziffer II und 51bis.1 Absatz 2 Ziffer II), für den Fall, daß eine Erklärung nach Regel 4.17 Ziffer IV nicht einschlägig ist Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, ein Patent zu beantragen und zu erhalten:
VIII-2-1 (B)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, ELBE, Hans-Ludwig
VIII-2-1 (B)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, RIECK, Heiko
VIII-2-1 (B)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, DUNKEL, Ralf
VIII-2-1 (B)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike
VIII-2-1 (E)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, KUCK, Karl-Heinz
VIII-2-1 (B)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, MAULER-MACHNIK, Aätrid
VIII-2-1 (E)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, KUGLER, Martin
VIII-2-1 (E)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, JAETSCH, Thomas
VIII-2-1 (B)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, WACHTLER, Peter
VIII-2-1 (B)		eine Vereinbarung zwischen BAYER AG und BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT vom 24 Oktober 2002 (24.10.2002)
VIII-2-1 (B)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten (mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika)

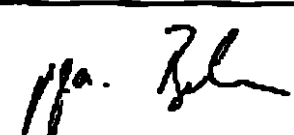
VII-3-1	Erklärung: Berechtigung, Priorität zu beanspruchen Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, eine Priorität zu beanspruchen, in Fällen, in denen der Anmelder nicht der Anmelder der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht wird, ist oder in Fällen, in denen sich der Name des Anmelders seit dem Einreichen der früheren Anmeldung geändert hat (Regeln 4.17 Ziffer B und 51bis.1 Absatz a Ziffer II): Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, die Priorität der früheren Anmeldung Nr. 10204391.4 zu beanspruchen:
VII-3-1 (B)		eine Vereinbarung zwischen BAYER AG und BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT vom 08 November 2002 (08.11.2002)
VII-3-1 (B)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten

PCT-ANTRAG

8/8

LEA36857-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 07.01.2003 10:32:29 AM

IX	Kontrollliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-1	Antrag (inklusive Erklärungsblätter)	8	-
IX-2	Beschreibung	45	-
IX-3	Ansprüche	8	-
IX-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
IX-5	Zeichnung(en)	0	-
IX-7	INSGESAMT	62	
	Beigefügte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigelegt	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-8	Bztl für die Gebührenberechnung	✓	-
IX-9	Original einer gesonderten Vollmacht	✓	-
IX-13	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1	-
IX-17	PCT-EASY-Datens	-	Diskette
IX-19	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
IX-20	Sprache der Int. Anmeldung	Deutsch	
X-1	Unterschrift des Anmelders, des Anwalts oder des Gemeinsamen Vertreters	 i. V. Dr. Alexander Nowak	
X-1-1	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT	

Dr. Dr. Axel Bader i. V. Dr. Alexander Nowak
VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en):	3
10-2-1	Eingegangen	
10-2-2	Nicht eingegangen	
10-3	Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingeg. Unterlage(n) oder Zeichnung(en) zur Vervollständigung dieser Int. Anmeldung	
10-4	Datum des fristgerechten Eingangs der Berichtigung nach PCT Artikel 11(2)	
10-5	Internationale Recherchenbehörde	ISA/EP
10-6	Übersmittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchengebühr aufgeschoben	

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

11-1	Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro	
------	---	--

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



INTERNATIONAL PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
14. August 2003 (14.08.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 03/066610 A1

not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 277/56.
A01N 43/78

50670 Köln (DE). WACHTLER, Peter [DE/DE]; Doer-
pferhofstr. 35, 47800 Krefeld (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/00539

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT; Legal and Patents, Patents
and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Januar 2003 (22.01.2003)

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SC, SD, SH, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 04 391 A 4. Februar 2002 (04.02.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-
SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789
Monheim (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
caribisches Patent (AM, AZ, BY, EG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NI, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ELBE, Hans-Lud-
wig [DE/DE]; Dammfelde 59, 42329 Wuppertal (DE).
RIECK, Helko [DE/FR]; 9, rue Claude-Monet, F-69110
St. Hov-les-Lyon (FR). DUNKEL, Ralf [DE/DE];
Krischenstr. 22, 40089 Monheim (DE). WACHEN-
DORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Obere Mark-
weg 81, 56566 Neuwied (DE). KUCK, Karl-Heinz
[DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30 a, 40764 Langenfeld (DE).
MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neupfälp-
weg 48, 42799 Leichlingen (DE). KUGLER, Martin
[DE/DE]; Am Kloster 47, 42799 Leichlingen (DE).
JAETSCH, Thomas [DE/DE]; Innere Kanalstr. 220.

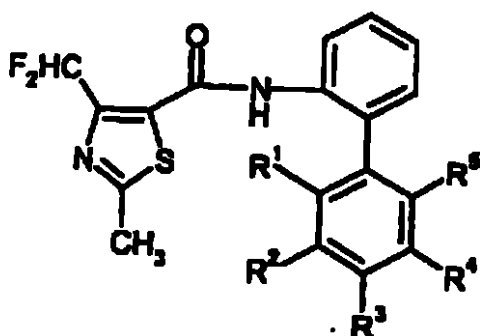
Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer i) für die
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK,
SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: DIFLUOROMETHYL THIAZOLYL CARBOXANILIDES

(54) Bezeichnung: DIFLUORMETHYL THIAZOLYL CARBOXANILIDE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to the novel difluo-
romethyl thiazolyl carboxanilides of formula (I), wherein
R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are defined as in the description.
The invention also relates to several methods for produc-
ing said substances and to their use for controlling unde-
sired microorganisms, as well as to novel intermediates
and their production.

(57) Zusammenfassung: Neue Difluormethylthia-
zolykarboxanilide der Formel (I) in welcher R¹, R²,
R³, R⁴ und R⁵ die in der Beschreibung angegebenen
Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zum Herstellen
dieser Stoffe und deren Verwendung zum Bekämpfen

von unerwünschten Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.

WO 03/066610 A1

hinichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer ii) für alle Bestimmungsstaaten

— mit internationalem Recherchebericht

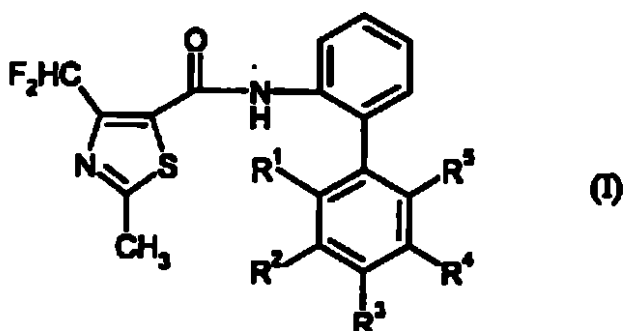
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Difluormethylthiazolylcarboxanilide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Difluormethylthiazolylcarboxanilide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von schädlichen Mikroorganismen im Pflanzenschutz und Materialschutz.

Es ist bereits bekannt geworden, dass zahlreiche Carboxanilide fungizide Eigenschaften besitzen (vergleiche z.B. EP-A 0 545 099). Die Wirksamkeit der dort beschriebenen Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I)



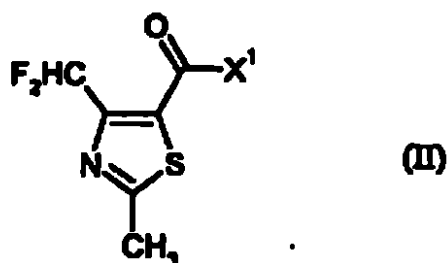
in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_2 - C_4 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, oder für C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen stehen, mit der Maßgabe, dass R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 nicht gleichzeitig für Wasserstoff stehen,

R^1 und R^2 oder R^2 und R^3 außerdem gemeinsam für gegebenenfalls durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Alkenylen stehen.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) erhält, indem man

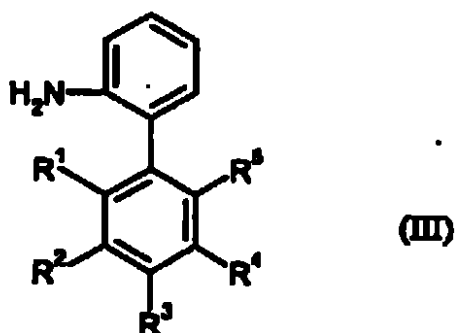
a) Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II)



5

in welcher
 X^1 für Halogen steht,

mit Anilinderivaten der Formel (III)



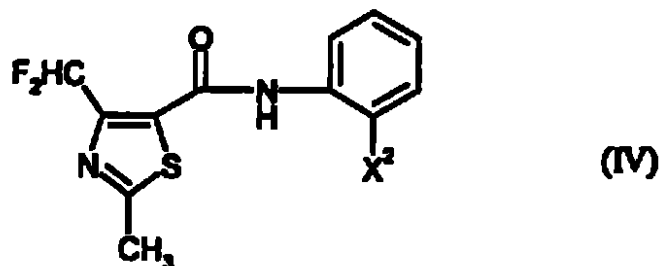
10

in welcher
 R^1, R^2, R^3, R^4 und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

15

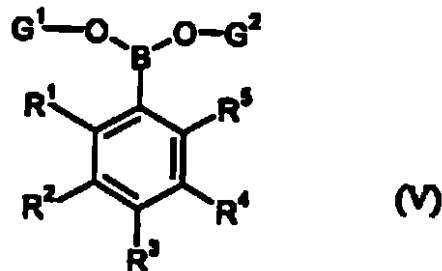
b) Difluormethylthiazolylcarboxhalogenanilide der Formel (IV)



in welcher

X^2 für Brom oder Iod steht,

mit Boronsäurederivaten der Formel (V)



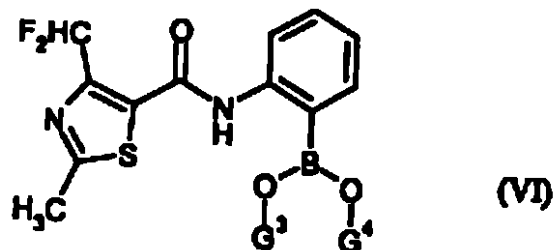
in welcher

R^1, R^2, R^3, R^4 und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

G^1 und G^2 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

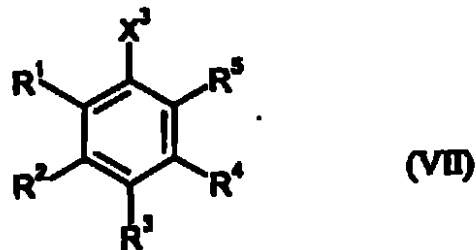
c) Difluormethylthiazolylcarboxanilid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI)



in welcher

G^3 und G^4 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

mit Halogenbenzolderivaten der Formel (VII)



in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X^3 für Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonyloxy steht,

5

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

10 Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

15 Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) eine wesentlich bessere fungizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Wirkstoffe gleicher Wirkungsrichtung.

20 Die erfindungsgemäßen Difluormethylthiazolylcarboxanilide sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

Bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

25 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethyl-

thio oder Trifluormethylthio stehen, mit der Maßgabe, dass R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 nicht gleichzeitig für Wasserstoff stehen,

5 R^1 und R^2 oder R^2 und R^3 außerdem gemeinsam für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiertes Butadienylen stehen.

Besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

10 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Methoxy, Methylthio, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio oder Trifluormethylthio stehen, mit der Maßgabe, dass R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 nicht gleichzeitig für Wasserstoff stehen.

15 Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

R^1 , R^2 , R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat.

20

Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

25 R^1 , R^2 , R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und R^3 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy oder Trifluormethylthio steht.

Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

30

R^1 , R^2 , R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und R^3 für Cyano steht.

Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

- 5 R^2, R^4 und R^5 für jeweils Wasserstoff stehen und
 R^1 und R^3 unabhängig voneinander die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

- 10 R^2, R^4 und R^5 für jeweils Wasserstoff stehen und
 R^1 und R^3 unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluor-
methyl stehen.

- 15 Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

R^1, R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^3 unabhängig voneinander die oben angegebenen Bedeutungen haben.

- 20 Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

- 25 R^1, R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluor-
methyl stehen.

Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

- 30 R^1, R^3 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^4 unabhängig voneinander die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Weiterhin ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher

R^1 , R^3 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und

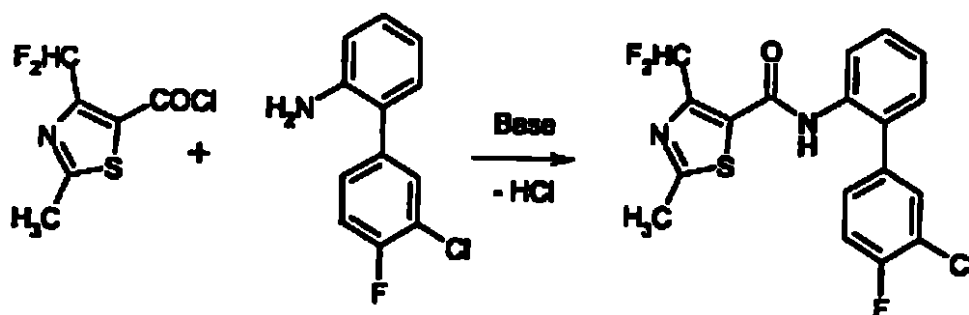
5 R^2 und R^4 unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl stehen.

Außerdem ganz besonders bevorzugt sind Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I), in welcher R^5 für Wasserstoff steht.

10

Verwendet man 2-Methyl-4-(difluormethyl)-1,3-thiazol-5-carbonylchlorid und 3'-Chlor-4'-fluor-1,1'-biphenyl-2-amin als Ausgangsstoffe sowie ein Base, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens a) durch folgende Reaktionsgleichung veranschaulicht werden:

15



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) steht X^1 bevorzugt für Chlor.

20

Die Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vergleiche z.B. EP-A 0 276 177).

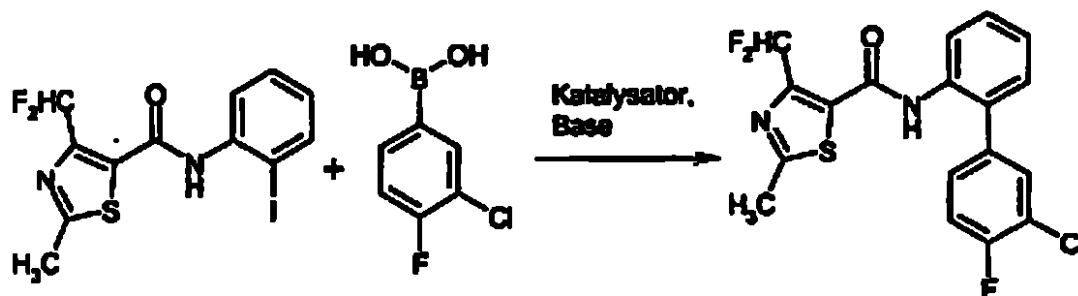
25

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Aniline sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) stehen R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 bevorzugt bzw. besonders bevorzugt für

diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

- 5 Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. z.B. Bull. Korean Chem. Soc. 2000, 21, 165-166; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-4; JP 09132567).

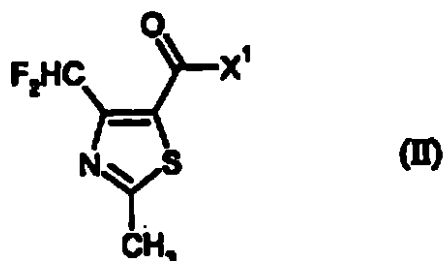
10 Verwendet man *N*-(2-Iodphenyl)-2-methyl-4-(difluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid und 3-Chlor-4-fluorphenylboronsäure als Ausgangsstoffe sowie einen Katalysator und eine Base, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens b) kann durch folgende Reaktionsgleichung veranschaulicht werden:



- 15 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Difluormethylthiazolylcarboxhalogenanilide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) steht X² bevorzugt für Brom oder Iod.

20 Die Difluormethylthiazolylcarboxhalogenanilide der Formel (IV) sind noch nicht bekannt. Sie sind neue chemische Verbindungen und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Sie werden erhalten, indem man

- d) Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II)



in welcher
X¹ für Halogen steht,

mit 2-Bromanilin oder 2-Iodanilin umgesetzt.

5

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe benötigten Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren a) beschrieben worden.

10

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe benötigten Stoffe 2-Bromanilin oder 2-Iodanilin sind bekannte Syntheschemikalien.

15

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Boronsäurederivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) stehen R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ bevorzugt bzw. besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. G¹ und G² stehen bevorzugt jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen.

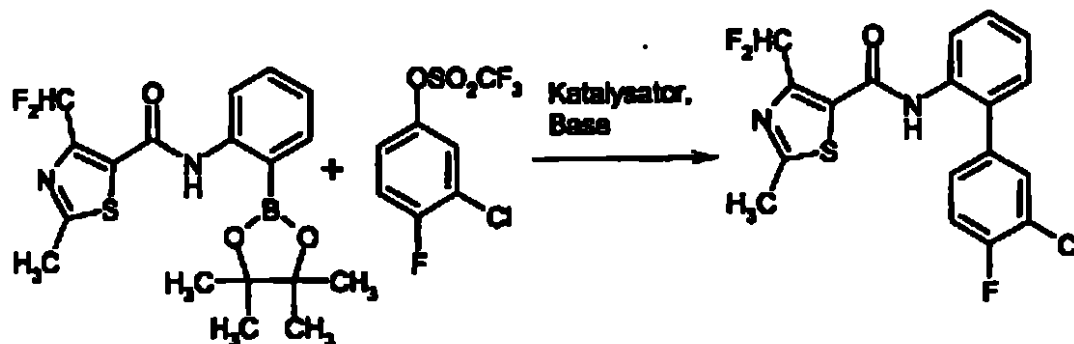
20

25

Boronsäurederivate der Formel (V) sind bekannte Syntheschemikalien. Sie können auch unmittelbar vor der Reaktion direkt aus Halogenbenzoldcrivaten und Boronsäureestern hergestellt und ohne Aufarbeitung weiter umgesetzt werden (siehe auch die Herstellungsbeispiele).

30

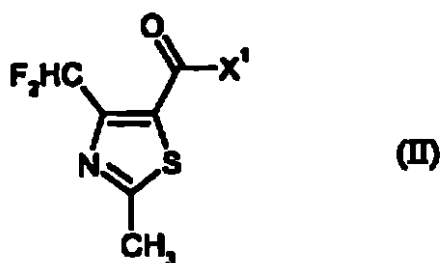
Verwendet man 2-Methyl-N-[2-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)phenyl]-4-(difluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid und 3-Chlor-4-fluorphenyl-trifluormethansulfonsäure als Ausgangsstoffe sowie einen Katalysator und eine Base, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens c) kann durch folgende Reaktionsgleichung veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten Difluormethylthiazolylcarboxanilid-Boronsäure-Derivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) stehen G^3 und G^4 bevorzugt jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen.

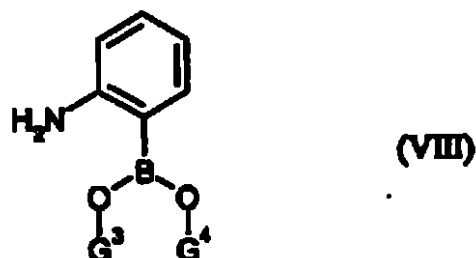
Die Difluormethylthiazolylcarboxanilid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI) sind noch nicht bekannt. Sie sind neue chemische Verbindungen und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Sie werden erhalten, indem man

e) Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II)



in welcher
 X^1 für Halogen steht,

mit Anilinboronsäurederivaten der Formel (VIII)



in welcher

G^3 und G^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

5

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe benötigten Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren a) beschrieben worden.

10

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe benötigten Anilinboronsäurederivate sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) stehen G^3 und G^4 bevorzugt jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen.

15

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe benötigten Anilinboronsäurederivate der Formel (VIII) sind bekannte Syntheschemikalien.

20

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenbenzolderivate sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) stehen R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 bevorzugt bzw. besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X^3 steht bevorzugt für Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonyloxy.

25

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren a), d) und e) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise

30

Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren a), d) und e) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren a), d) und e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenides der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Anilinderivat der Formel (III) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III) setzt man pro Mol des Difluormethylthiazolylcarbonsäure-

halogenides der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an 2-Bromanilin oder 2-Iodanilin ein.

5 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VI) setzt man pro Mol des Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenides der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Anilinboronsäurederivat der Formel (VIII) ein.

10 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren b) und c) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-
15 Dicthoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

25 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahrens b) und c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

30 Die erfindungsgemäßen Verfahren b) und c) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, fluoride,

phosphate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithiumdiisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Natriumphosphat, Kaliumphosphat, Kaliumfluorid, Cäsiumfluorid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Cäsiumcarbonat, sowie

5 tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

10

Die erfindungsgemäßen Verfahren b) und c) werden in Gegenwart eines Katalysators, wie beispielsweise eines Palladiumsalzes oder -komplexes, durchgeführt. Hierzu kommen vorzugsweise Palladiumchlorid, Palladiumacetat, Tetrakis-(triphenylphosphin)-Palladium, Bis-(triphenylphosphin)-Palladiumdichlorid oder 1,1'-Bis(di-

15 phenylphosphino)ferrocenpalladium(II)chlorid infrage.

Es kann auch ein Palladiumkomplex in der Reaktionsmischung erzeugt werden, wenn man ein Palladiumsalz und ein Komplexligand, wie beispielsweise Triethylphosphan, Tri-tert-butylphosphan, Tricyclohexylphosphan, 2-(Dicyclohexylphosphan)-biphenyl, 2-(Di-tert-butylphosphan)-biphenyl, 2-(Dicyclohexylphosphan)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, Triphenylphosphan, Tris-(o-Tolyl)-phosphan, Natrium-3-(diphenylphosphino)benzolsulfonat, Tris-2-(Methoxyphenyl)-phosphan, 2,2'-Bis-(diphenylphosphan)-1,1'-binaphthyl, 1,4-Bis-(diphenylphosphan)-butan, 1,2-Bis-(diphenylphosphan)-ethan, 1,4-Bis-(dicyclohexylphosphan)-butan, 1,2-Bis-(dicyclohexylphosphan)-ethan, 2-(Dicyclohexylphosphan)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, Bis(diphenylphosphino)ferrocen oder Tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphit getrennt

20 zur Reaktion zugibt.

25

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Difluormethylthiazolylcarboxhalogenanilide der Formel (IV) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol an Boronsäurederivat der Formel (V) ein.

30

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Difluormethylthiazolylcarboxanilid-Boronsäure-Derivates der Formel (VI) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol an Halogenbenzolderivat der Formel (VII) ein.

5

Die erfindungsgemäßen Verfahren a), b), c) und d) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - zu arbeiten.

10

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

15

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

20

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

25

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;

Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder

30

Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;

- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
5 Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
10 Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
15 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
20 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.
25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in
Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte
gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.
- 30 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden
Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehr-
system von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfol-

gender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

5 Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

10 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

25 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch
30 Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflan-

zenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch
5 Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder
10 Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.
15

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind.
20 Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch
25 Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

30

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und

31

Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, Holzverfärbende und Holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

- 5 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:
Alternaria, wie Alternaria tenuis,
Aspergillus, wie Aspergillus niger,
Chaetomium, wie Chaetomium globosum,
Coniophora, wie Coniophora puetana,
- 10 Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
Penicillium, wie Penicillium glaucum,
Polyporus, wie Polyporus versicolor,
Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
- 15 Trichoderma, wie Trichoderma viride,
Escherichia, wie Escherichia coli,
Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.
- 20 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.
- 25 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln
- 30 und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie

Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzenentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

10

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

- Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprime, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,
- 15 Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Carpropamid, Capsinmycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolimat, Clozylacon, Cufraneb,
- 20 Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Dicllofuanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 25 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenhexamid, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol,
- 30 Furconazol-cis, Furnecyclox, Guazatin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

- Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Iprovalicarb, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,
- 5 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,
- Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mcpronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomyacin, Myclobutanil, Myclozolin,
- 10 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazo-
- 15 phos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyflur, Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen, Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine, Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyo-
- 20 fen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol, Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol, Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
- Dagger G, OK-8705, OK-8801,
- 25 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 30 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon, (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid, 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,

- 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
 5 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
 1-[1-{2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl}-ethenyl]-1H-imidazol,
 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
 10 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-
 15 methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyاناتomethyl)-acetamid,
 20 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 25 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 8-Hydroxychinolinsulfat,
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 30 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
 hydrochlorid,

- Ethyl-[(4-chlorophenyl)-azo]-cyanoacetat,
 Kaliumhydrogencarbonat,
 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 5 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 10 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl-cyclopropanecarboxamid,
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 15 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin-Natriumsalz,
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
 20 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
 4-[3,4-Dimethoxyphenyl]-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl-morpholin

Bakterizide:

- 25 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,
 Oethilnon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam,
 Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

- 30 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

- Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,
 Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Ben-
 sultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Bio-
 permethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos,
 5 Butocarboxim, Butylpyridaben,
 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloetho-
 carb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos,
 Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin,
 Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos,
 10 Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin,
 Cyromazine,
 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,
 Dichlorvos, Dicofol, Disflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan,
 Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,
 15 Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopsthora spp., Easfen-
 valerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrinfos,
 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim,
 Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate,
 Fipronil, Fluazuron, Flubrocycrin, Flucyclohexuron, Flucythrinate, Flufenoxuron,
 20 Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate,
 Fubfenprox, Furathiocarb,
 Granuloseviren
 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
 Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,
 25 Kempolyederviren, Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
 Malathion, Mecarban, Metaldchyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
 Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl, Meth-
 oxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin,
 Monocrotophos,
 30 Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron, Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M,
 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
 Phorat, Phosalonc, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,

- Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyreasmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Ribavirin, Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,
- 5 Tan-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Thetacypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Traloccythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Tri-
- 10 flumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii, YI 5302, Zeta-cypermethrin, Zolaprofos
- (1R-cis)-{5-(Phenylmethyl)-3-furanyl}-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat
- 15 (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
- 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin
- 2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
- 2-(Acethoxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 20 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 3-Methylphenyl-propylcarbamate
- 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
- 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-
- 25 3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorophenyl)-3(2H)-pyridazinon
- Bacillus thuringiensis strain EG-2348
- 30 Benzoesture [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid
- Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorophenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ester

- [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat
 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
 5 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid
 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin
 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
 N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid
 10 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat
 N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid
 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol
 15 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.
- Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimyko-
 20 tisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die
 25 Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus be-
 reiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritz-
 30 pulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die

Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

- 5 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.
- 10
- 15 Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.
- 20
- 25 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.
- 30

36

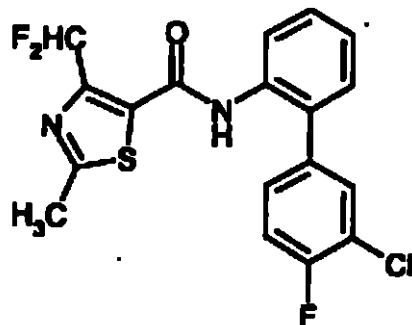
Jc nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß ver-
5 wendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen
15 besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften
20 sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden.
25 Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die

Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen).

Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Herstellungsbeispiele**Beispiel 1****5 Verfahren a)**

0,288 g (1,3 mmol) 3'-Chlor-4'-fluor-1,1'-biphenyl-2-amin und 0,33 g (1,5 mmol) 2-Methyl-4-(difluormethyl)-1,3-thiazol-5-carbonylchlorid werden in 6 ml Tetrahydrofuran gelöst und mit 0,36 ml (2,6 mmol) Triethylamin versetzt. Die Reaktionslösung wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird aufkonzentriert und mit
 10 Cyclohexan/Essigsäureethylester an Kieselgel chromatographiert.

Man erhält 0,434 g (84 % d. Th.) an *N*-(3'-Chlor-4'-fluor-1,1'-biphenyl-2-yl)-2-methyl-4-(difluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid mit dem logP (pH2,3) = 3,28.

15 Analog Beispiel 1, sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Beschreibungen der Verfahren a) und b), werden die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

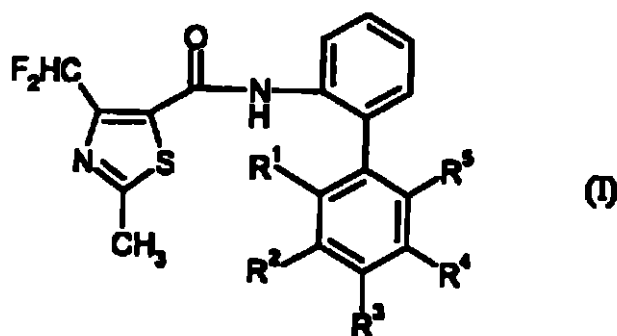
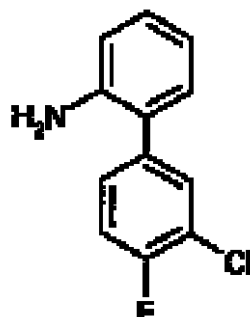


Tabelle 1

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	logP
2	H	H	Br	H	H	3,47
3	H	H	CF ₃	H	H	3,52
4	H	Cl	H	H	H	3,37
5	H	H	OCF ₃	H	H	3,72
6	H	H	SCH ₃	H	H	3,39
7	H	H	F	H	H	3,09
8	H	Cl	Cl	H	H	3,58
9	Cl	H	Cl	H	H	3,58
10	CH ₃	H	Cl	H	H	3,77
11	H	F	Cl	H	H	3,29
12	H	Cl	CH ₃	H	H	3,62
13	F	H	Cl	H	H	3,26
14	H	F	H	Cl	H	3,36
15	F	H	Br	H	H	3,34
16	H	CH ₃	Cl	H	H	3,66
17	H	Cl	H	Cl	H	3,7
18	H	F	H	F	H	3,07
19	H	CF ₃	Cl	H	H	3,66
20	H	F	F	H	H	3,04
21	H	H	Cl	H	H	3,27
22	H	F	Br	H	H	3,36
23	H	F	CF ₃	H	H	3,43
24	F	H	F	H	H	2,93
25	H	H	CN	H	H	2,51
26	H	H	H	H	H	3,50

Herstellung eines Vorproduktes der Formel (II)

Beispiel (UI-1)



38,8 g (223 mmol) 3-Chlor-4-fluorphenylboronsäure, 40,6 g (186 mmol) 2-Iodanilin werden in 220 ml Toluol, 22 ml Ethanol und 45 ml einer 4 M Natriumhydrogencarbonatlösung unter Argon gelöst. Hierzu gibt man 4,3 g (4 mmol) Tetrakis(triphenylphosphin)palladium(0) lässt die Reaktionslösung 16 Stunden bei 80 °C unter Argon röhren. Die organische Phase wird abgetrennt, über Magnesiumsulfat getrocknet und aufkonzentriert. Der Rückstand wird mit Cyclohexan/Essigsäureethylester an Kieselgel chromatographiert.

Man erhält 22,5 g (48 % d. Th.) 3'-Chlor-4'-fluor-1,1'-biphenyl-2-amin (Reinheit 88%) mit dem $\log P$ ($pH 2,3$) = 3,01.

Die Bestimmung der in den voranstehenden Tabellen und Herstellungsbeispielen angegebenen logP-Werte erfolgt gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

Die Bestimmung erfolgt im sauren Bereich bei pH 2.3 mit 0,1 % wässriger Phosphorsäure und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

10

Die Eichung erfolgt mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

15

Die λ -max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele

Beispiel A

5

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

10 Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidien suspension des Apfelschorrförers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskammer.

20

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90% aufgestellt.

25

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle A:**Venturia - Test (Apfel) / protektiv**

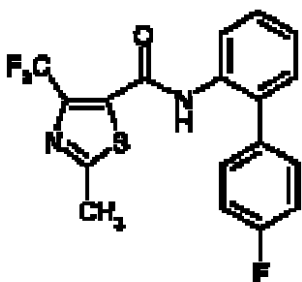
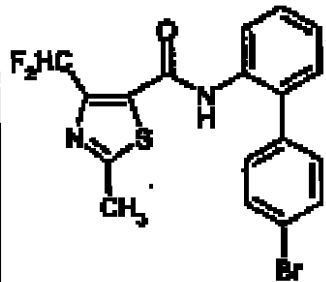
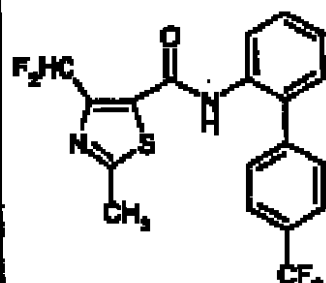
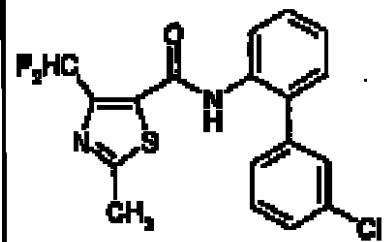
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
Gemäß EP-A 0 545 099:			
3.37		10	32
Erfindungsgemäß:			
2		10	100
3		10	100
4		10	100

Tabelle A:**Venturia - Test (Apfel) / protektiv.**

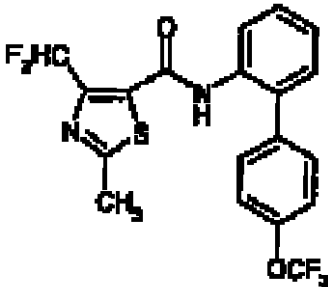
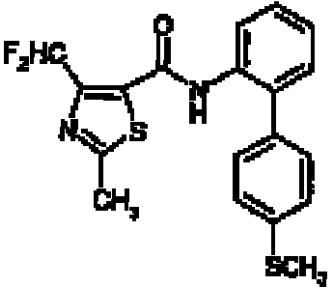
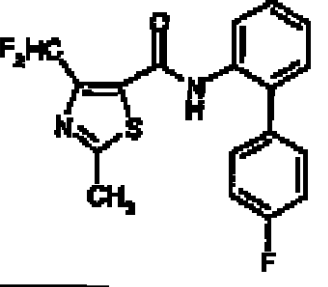
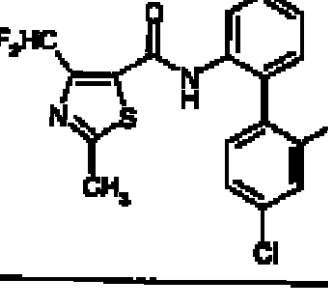
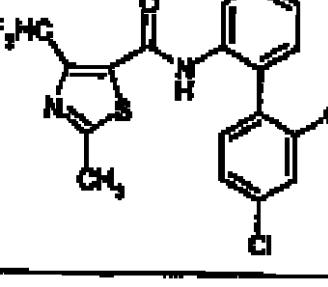
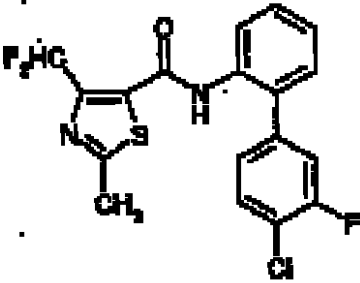
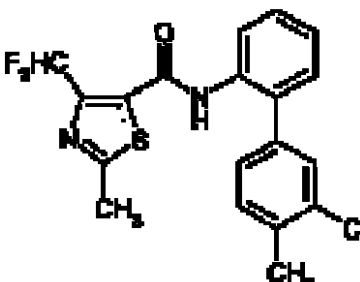
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
5		10	87
6		10	99
7		10	100
9		10	98
10		10	100

Tabelle A: Venturia - Test (Apfel) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
11		10	100
12		10	100

Beispiel B**Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

- 5 **Lösungsmittel:** 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Austrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit *Botrytis cinerea* bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

20 2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabella B:**Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

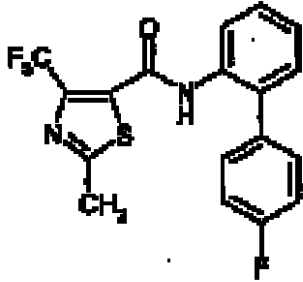
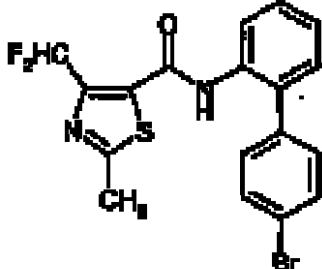
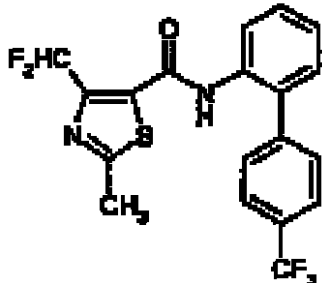
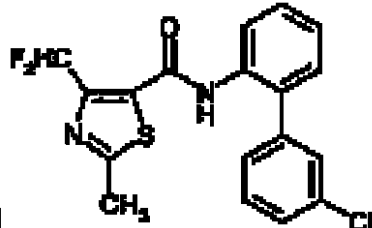
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
Gemäß EP-A 0 545 099:			
3.37		100	50
Erfindungsgemäß:			
2		100	100
3		100	100
4		100	100

Tabelle II:**Botrytis - Test (Bohne) / präventiv**

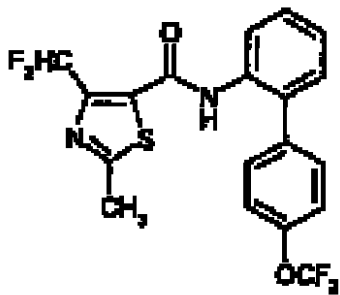
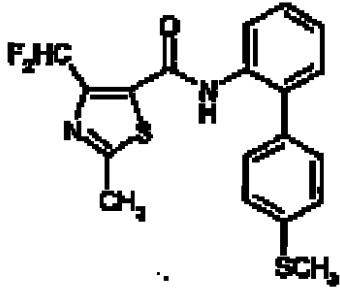
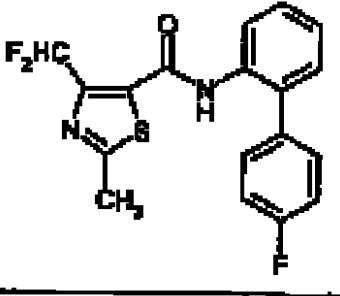
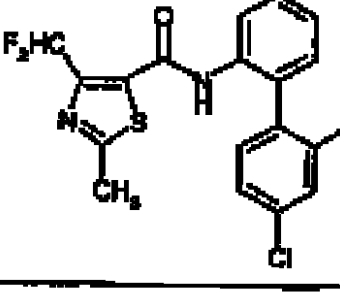
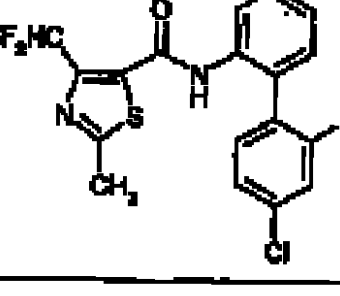
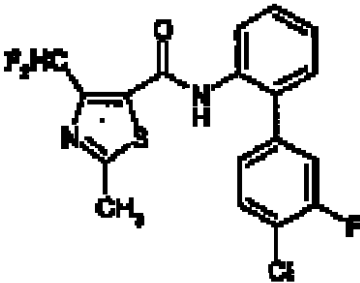
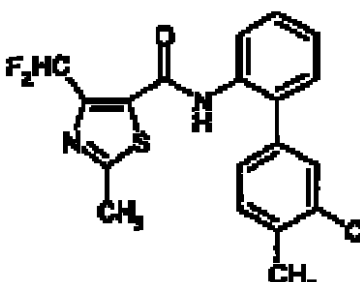
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
5		100	79
6		100	94
7		100	94
9		100	95
10		100	100

Tabella B: Botrytis - Test (Bohne) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
11		100	100
12		100	100

Beispiel C

In vitro-Test zur ED_{50} -Bestimmung bei Mikroorganismen

5

In die Kavitäten von Mikrotiterplatten wird eine methanolische Lösung des zu prüfenden Wirkstoffs, versetzt mit dem Emulgator PS16, pipettiert. Nachdem das Lösungsmittel abgedampft ist, werden je Kavität 200 µl Potato-Dextrose-Medium hinzugefügt.

10

Das Medium wurde vorher mit einer geeigneten Konzentration von Sporen bzw. Mycel des zu prüfenden Pilzes versetzt.

15

Die resultierenden Konzentrationen des Wirkstoffs betragen 0,1, 1, 10 und 100 ppm. Die resultierende Konzentration des Emulgators beträgt 300 ppm.

20

Die Platten werden anschließend 3-5 Tage auf einem Schüttler bei einer Temperatur von 22°C inkubiert bis in der unbehandelten Kontrolle ein ausreichendes Wachstum feststellbar ist.

25

Die Auswertung erfolgt photometrisch bei einer Wellenlänge von 620 nm. Aus den Messdaten der verschiedenen Konzentrationen wird die Wirkstoffdosis, die zu einer 50%igen Hemmung des Pilzwachstums gegenüber der unbehandelten Kontrolle führt (ED_{50}), berechnet.

Tabelle C:**In vitro-Test zur ED₅₀-Bestimmung bei Mikroorganismen**

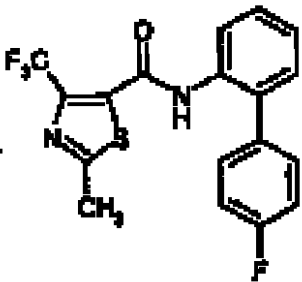
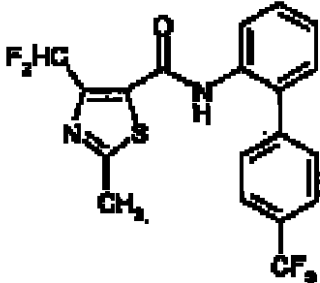
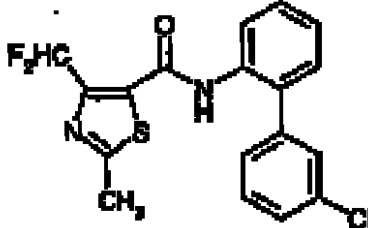
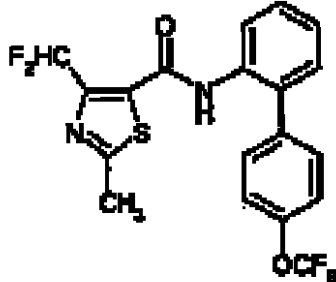
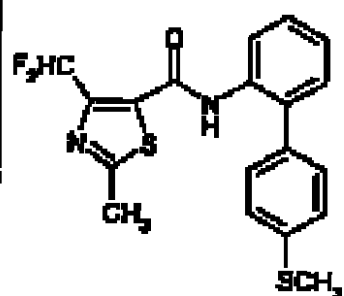
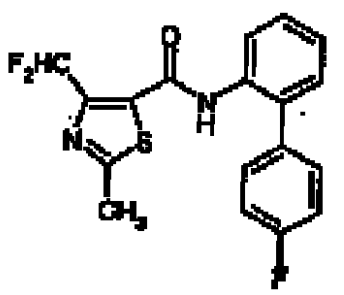
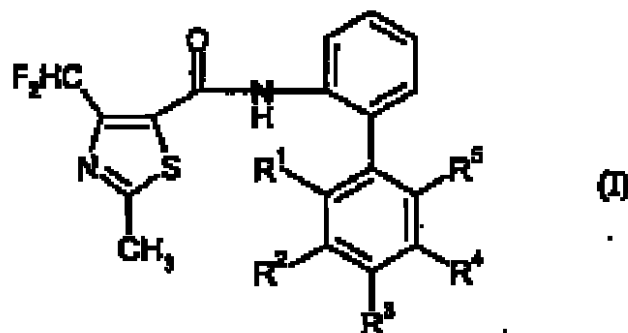
Bsp.	Wirkstoff	Mikroorganismus	ED ₅₀ -Wert
Gemäß EP-A 0 545 099:			
3.37		<i>Rhizoctonia solani</i> <i>Septoria tritici</i>	> 100 84,24
Erfindungsgemäß:			
3		<i>Rhizoctonia solani</i> <i>Septoria tritici</i>	< 0,1 0,36
4		<i>Rhizoctonia solani</i> <i>Septoria tritici</i>	< 0,1 0,45
5		<i>Rhizoctonia solani</i> <i>Septoria tritici</i>	< 0,1 0,25

Tabelle C:**In vitro-Test zur ED₅₀-Bestimmung bei Mikroorganismen**

Bsp.	Wirkstoff	Mikroorganismus	ED ₅₀ -Wert
6		<i>Rhizoctonia solani</i> <i>Septoria tritici</i>	3,25 3,51
7		<i>Rhizoctonia solani</i> <i>Septoria tritici</i>	0,48 0,68

Patentansprüche

1. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I)



5

in welcher

10

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, oder für C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen stehen, mit der Maßgabe, dass R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 nicht gleichzeitig für Wasserstoff stehen,

15

R^1 und R^2 oder R^3 und R^4 außerdem gemeinsam für gegebenenfalls durch Halogen oder C_1 - C_6 -Alkyl substituiertes Alkenyl stehen.

2. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

20

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, *n*- oder *i*-Propyl, *n*-, *i*-, *s*- oder *t*-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, *n*- oder *i*-Propylthio, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorchlormethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trifluormethylthio stehen, mit der Maßgabe, dass R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 nicht gleichzeitig für Wasserstoff stehen,

25

R^1 und R^2 oder R^2 und R^3 außerdem gemeinsam für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiertes Butadienyl stehen.

3. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in
5 welcher

R^1, R^2, R^3, R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Methoxy, Methylthio, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio oder Trifluormethylthio stehen, mit der Maßgabe, dass R^1, R^2, R^3, R^4 und R^5 nicht gleichzeitig für Wasserstoff stehen.

4. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in
welcher

R^1, R^2, R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
15 R^3 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat.

5. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in
welcher

R^1, R^2, R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
20 R^3 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy oder Trifluormethylthio steht.

6. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in
welcher

R^2, R^4 und R^5 für jeweils Wasserstoff stehen und
25 R^1 und R^3 unabhängig voneinander die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

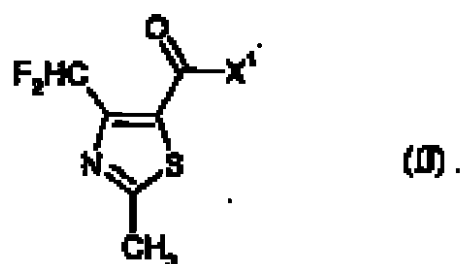
7. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in
welcher

30 R^2, R^4 und R^5 für jeweils Wasserstoff stehen und

R^1 und R^3 unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl stehen.

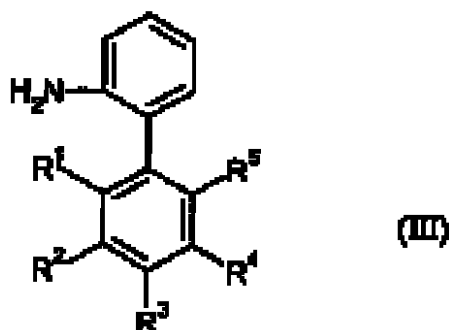
- 5 8. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 R^1, R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^3 unabhängig voneinander die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.
- 10 9. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 R^1, R^4 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl stehen.
- 15 10. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 R^1, R^3 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^4 unabhängig voneinander die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.
- 20 11. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 R^1, R^3 und R^5 jeweils für Wasserstoff stehen und
 R^2 und R^4 unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl stehen.
- 25 12. Difluormethylthiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher R^5 für Wasserstoff steht.
- 30 13. Verfahren zum Herstellen von Difluormethylthiazolylcarboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

a) Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II)



in welcher
X¹ für Halogen steht,

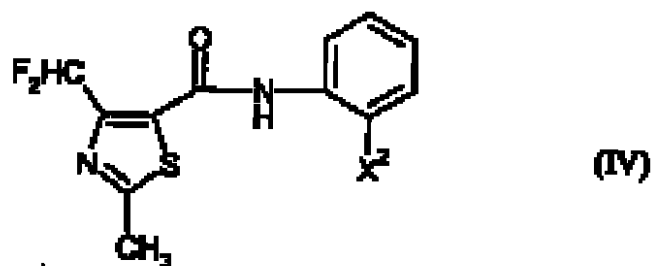
mit Anilinderivaten der Formel (III)



in welcher
R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen
haben,

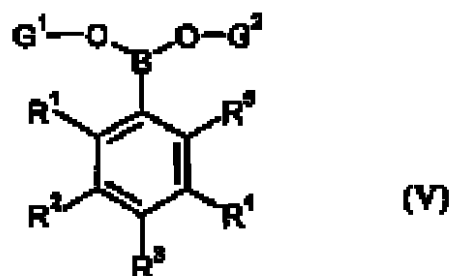
gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenen-
falls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

b) Difluormethylthiazolylcarboxhalogenanilide der Formel (IV)



in welcher
X² für Brom oder Iod steht,

mit Borsäurederivaten der Formel (V)



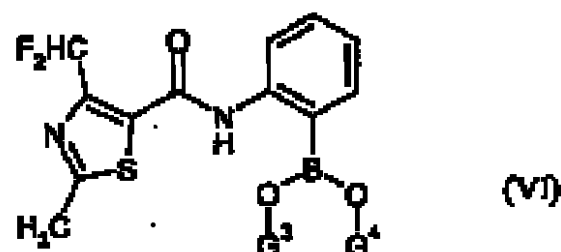
in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

G^1 und G^2 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

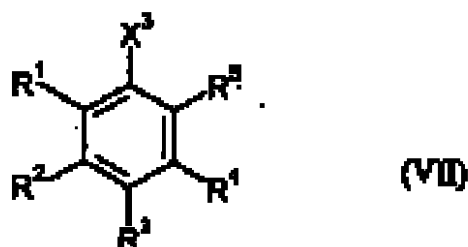
c) Difluormethylthiazolylcarboxamid-Borsäure-Derivate der Formel (VI)



in welcher

G^3 und G^4 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

mit Halogenbenzolderivaten der Formel (VII)



in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X^3 für Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonyloxy steht,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

10

14. Mittel zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Thiazolylcarboxanilid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

15

15. Verwendung von Thiazolylcarboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.

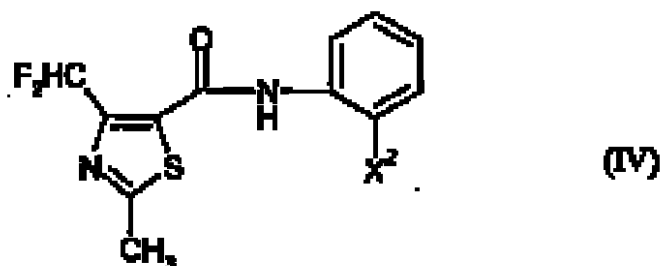
20

16. Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Thiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

25

17. Verfahren zum Herstellen von Mitteln zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Thiazolylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

18. Difluormethylthiazolylcarboxhalogenanilide der Formel (IV)

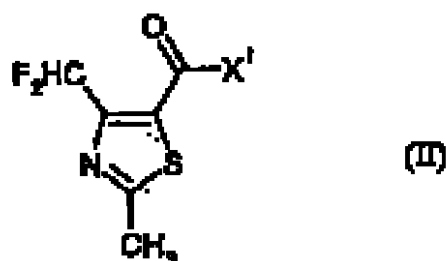


in welcher

X^2 für Brom oder Iod steht.

- 5 19. Verfahren zum Herstellen von Difluormethylthiazolylcarboxhalogenaniliden der Formel (IV) gemäß Anspruch 18, dadurch gekennzeichnet, dass man

d) Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II)



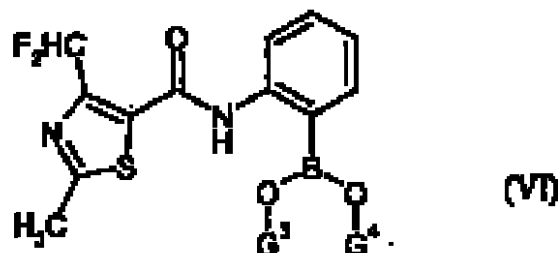
10

in welcher

X^1 für Halogen steht,

mit 2-Bromanilin oder 2-Iodanilin umsetzt.

- 15 20. Difluormethylthiazolylcarboxanilid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI)

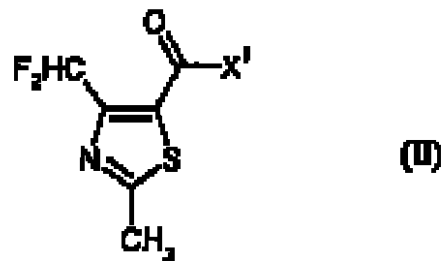


In welcher

G^3 und G^4 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen.

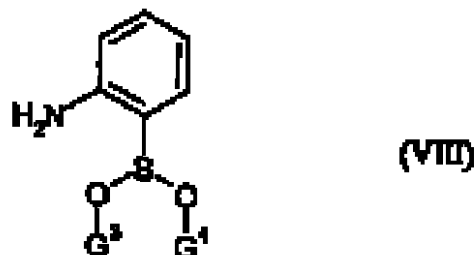
21. Verfahren zum Herstellen von Difluormethylthiazolylcarboxamid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI) gemäß Anspruch 20, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 5 e) Difluormethylthiazolylcarbonsäurehalogenide der Formel (II)



in welcher
 X^1 für Halogen steht,

- 10 mit Anilinboronsäurederivaten der Formel (VIII)



in welcher
 G^3 und G^4 die in Anspruch 20 angegebenen Bedeutungen haben,

- 15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt;

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 03/00689

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D277/56 ADIN43/78

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D ADIN

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

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

EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 545 099 A (BASF AG) 9 June 1993 (1993-06-09) cited in the application page 15-18	1-21
A	WD 97 08148 A (BASF AG ;EICKEN KARL (DE); RANG HARALD (DE); HARREUS ALBRECHT (DE)) 6 March 1997 (1997-03-06) tables	1-21
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN Vol. 2002, no. 02, 2 April 2002 (2002-04-02) & JP 2001 302605 A (SUMITOMO CHEM CO LTD), 31 October 2001 (2001-10-31) abstract; table 6	1-21

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

* Special categories of cited documents:

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier documents but published on or after the international filing date

L document which may throw doubt on priority claims or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to underpin the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, each combination being obvious to a person skilled in the art

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

4 April 2003

Date of mailing of the international search report

11/04/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. Box 5815, München 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx, 31 551 spa nl,
Fax: (+31-70) 340-2010

Authorized officer

Lauré, P

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

or
 PCT/EP 03/00589

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0545099	A	09-06-1993	AT	149487 T	15-03-1997
			AU	656243 B2	27-01-1995
			AU	2855492 A	27-05-1993
			CA	2081935 A1	23-05-1993
			CZ	9203448 A3	13-10-1993
			CZ	289478 B6	16-01-2002
			DE	59208113 D1	10-04-1997
			DK	545099 T3	24-03-1997
			EP	0545099 A2	09-06-1993
			ES	2098421 T3	01-05-1997
			FR	3023336 T3	29-08-1997
			HU	62861 A2	28-06-1993
			IL	103614 A	24-09-1998
			JP	3202079 B2	27-08-2001
			JP	5221994 A	31-08-1993
			JP	2001263802 A	18-09-2001
			JP	2001316210 A	13-11-2001
			KR	267518 B1	16-10-2000
			NZ	245194 A	27-02-1996
			PL	296677 A1	18-10-1993
			SK	344892 A3	08-03-1995
			US	5480897 A	02-01-1996
			US	5556988 A	17-09-1996
			US	5589493 A	31-12-1996
			US	5330995 A	19-07-1994
			ZA	9208977 A	19-05-1994
WO 9708148	A	06-03-1997	DE	19531813 A1	06-03-1997
			AU	6928596 A	19-03-1997
			WO	9708148 A1	06-03-1997
			EP	0847388 A1	17-06-1998
			JP	11511449 T	05-10-1999
			US	5998450 A	07-12-1999
JP 2001302605	A	31-10-2001	NONE		

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Industrielles Aimsatzzeichen

PCT/EP 03/00589

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D277/56 A01N43/78

Nach der Internationalen Patentsklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mischpolymer (Kunststoffsystem und Klassifikationsartikels)
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte oder nicht zum Mindestmaßteil gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data

C. ALS WESSENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Dat. Ausspr. Nr.
A	EP 0 545 099 A (BASF AG) 9. Juni 1993 (1993-06-09) in der Anmeldung erwähnt Seite 15-18	1-21
A	WO 97 08148 A (BASF AG ; EICKEN KARL (DE); RANG HARALD (DE); HARREUS ALBRECHT (DE)) 6. März 1997 (1997-03-06) Tabellen	1-21
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 02, 2. April 2002 (2002-04-02) & JP 2001 302605 A (SUMITOMO CHEM CO LTD), 31. Oktober 2001 (2001-10-31) Zusammenfassung; Tabelle 6	1-21

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E Status Dokument, das jedoch erst zu oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die (ausnahmsweise) in einem Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie angegeben)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Erfindung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht wurden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern für zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie geeignet ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung: die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindungsfähiger Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindungsfähiger Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung als einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

4. April 2003

Abschlußdatum des internationalen Recherchenberichts

11/04/2003

Name und Postanschrift der internationalen Recherchebehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5518 Patentamt 2
NL-2280 HV The Hague
Tel. (+31-70) 940-2000, Fax (+31-70) 940-2001
Fax (+31-70) 240-3818

Bevollmächtigter Beauftragter

Lauro, P

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference LE435857-WO	FOR FURTHER ACTION See Notification/Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/PEA/415)	
International application No. PCT/EP03/00589	International filing date (day/month/year) 22 January 2003 (22.01.03)	Priority date (day/month/year) 04 February 2002 (04.02.02)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 277/56, A01N 43/78		
Applicant BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT		

- This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 2 sheets, including this cover sheet.
☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been appended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 697 of the Administrative Instructions under the PCT).
These annexes consist of a total of sheets.

- This report contains indications relating to the following items:

- ☒ Basis of the report
- ☐ Priority
- ☐ New-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- ☐ Lack of unity of invention
- ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- ☐ Certain documents cited
- ☐ Certain defects in the international application
- ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 26 June 2003 (26.06.03)	Date of completion of this report 29 July 2003 (29.07.2003)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

Form PCT/PEA/409 (cover sheet) (July 1998)

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. PCT/EP03/00589

I. Basis of the report

The basis of international preliminary examination report is the application as originally filed.

V. Reasoned statement under Rule 66.2(a)(II) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability

In light of the documents cited in the international search report, it is considered that the invention as defined in the claims meets the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. it appears to be novel and to involve an inventive step.

Traducción

63

TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES
PCT
INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

Referencia del expediente del agente o solicitante LEA 35857-WO	PARA ACTUACIONES ADICIONALES Ver notificación de Transmisión del Reporte de Examen Preliminar (Formulario PCT/PEA/16)	
Solicitud internacional No. PCT/EP03/00589	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 22 de enero de 2003	Fecha de prioridad (día/mes/año) 4 de febrero de 2002
Clasificación internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional o IPC C07D 277/06, A01N 43/78		
Solicitante BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT		

1. Este informe de examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Administración encargada del Examen Preliminar Internacional y se envía al solicitante en concordancia con el artículo 36.

2. Este INFORME consta de una total de 2 hojas, incluyendo la portada

☐ Este informe también se acompaña de ANEXOS, esto es documentos de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos que han sido corregidos y que son la base de este informe y/o documentos que contienen rectificaciones realizadas ante esta Administración (Ver Regla 70.16 y Sección 607 de las Instrucciones Administrativas según el PCT)

Estos anexos constan de un total de _____ hojas.

3. Este informe contiene indicaciones relativas a los siguientes aspectos:

- I ☒ Fundamentos del Informe
- II ☐ Prioridad
- III ☐ No se establece concepto relativo a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial
- IV ☐ Carencia de unidad de la invención
- V ☒ Declaración razonada según el artículo 35(2), en relación con la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citaciones y explicaciones que soportan dicha declaración
- VI ☐ Ciertos documentos citados
- VII ☐ Ciertos defectos de la solicitud internacional
- VIII ☐ Ciertas observaciones respecto a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la demanda 28.06.2003	Fecha de terminación de este reporte 29.07.2003
Nombre y dirección de correo de la autoridad encargada del examen preliminar	Funcionario Autorizado Teléfono No.

I. Base del informe

La base del informe de examen preliminar internacional es la solicitud de patente como presentada originalmente.

V. Declaración motivada según el Artículo 35(2) en cuanto a la novedad, el nivel inventivo y la aplicación industrial

A la luz de los documentos citados en el informe de búsqueda internacional, se considera que la invención como se define en las reivindicaciones cumple con los criterios mencionados en el artículo 33(1) del PCT, es decir, parece ser novedosa y constituir un nivel inventivo.

DIFLUORMETILTIAZOLILCARBOXANILIDAS.

Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevas difluormetiltiazolilcarboxanilidas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra microorganismos dañinos en la protección de las plantas y en la protección de los materiales.

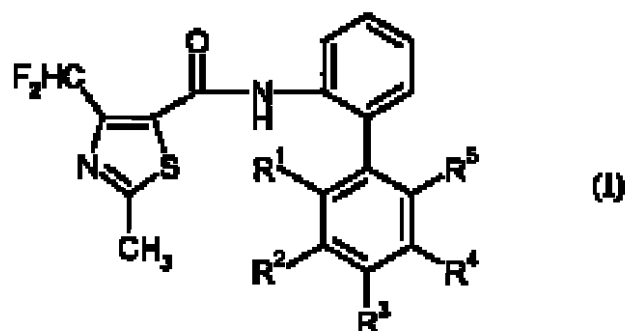
Antecedentes de la invención

Se ha dado ya a conocer, que un gran número de carboxanilidas tienen propiedades fungicidas (véase por ejemplo la publicación EP-A 0 545 099). La actividad de los productos allí descritos es buena pero, sin embargo, deja mucho que desear en algunos casos con ocasión de cantidades bajas de aplicación.

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado ahora nuevas difluormetiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula

(I)



en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitró, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, o significa halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi

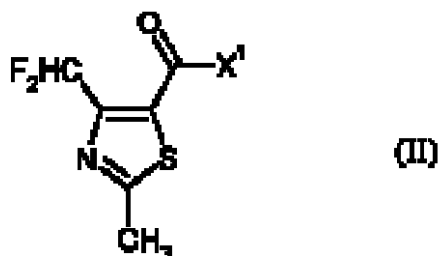
- 2 -

con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilitio con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, con la condición de que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 no signifiquen, simultáneamente, hidrógeno,

- 5 R^1 y R^2 o R^2 y R^3 significan, además, conjuntamente alquencileno sustituido, en caso dado, por halógeno o por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

Además, se ha encontrado que se obtienen las difluormetilthiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), si

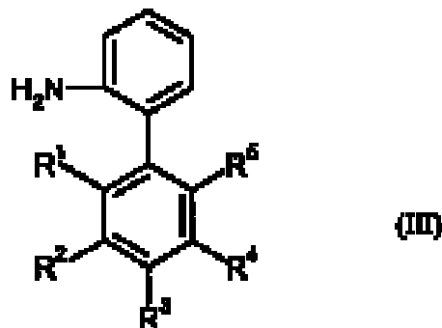
- 10 a) se hacen reaccionar halogenuros del ácido difluormetilthiazolilcarboxílico de la fórmula (II)



en la que

X^1 signifien halógeno,

con derivados de anilina de la fórmula (III)



15

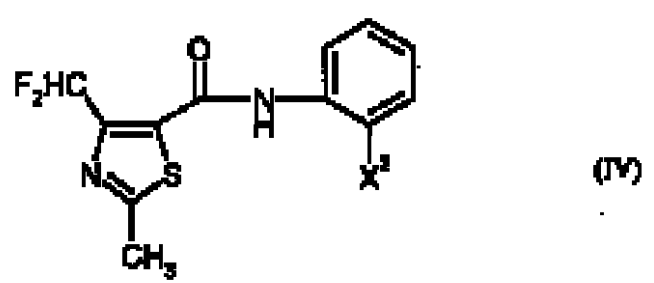
en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en

presencia de un diluyente, o

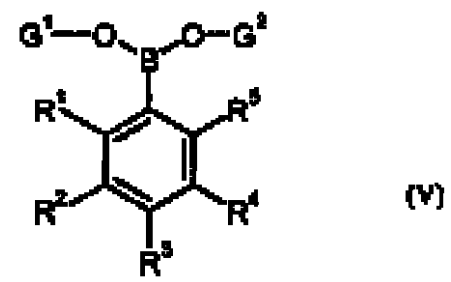
b) se hacen reaccionar difluorometiltiazolilcarboxihalogenoanilidas de la fórmula (IV)



en la que

5 X² significa bromo o yodo,

con derivados del ácido borónico de la fórmula (V)



en la que

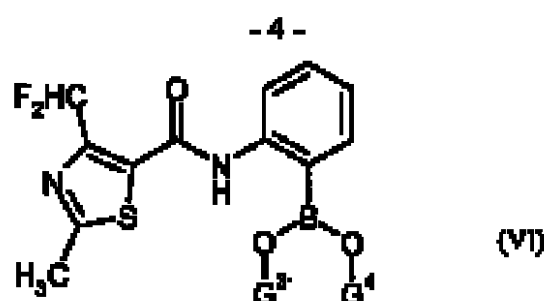
R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados anteriormente indicados,

10 G¹ y G² significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametiletileno,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

c) se hacen reaccionar derivados de la difluorometiltiazolilcarboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI)

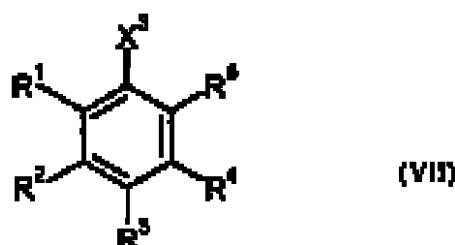
15



en la que

G^3 y G^4 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametiletileno,

5 con derivados de halógenobenceno de la fórmula (VII)



en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

X^3 significa bromo, yodo o trifluormetilsulfonilo,

10 en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

Finalmente se ha encontrado que las nuevas difluormetiltiazolilcarboxamidas de la fórmula (I) tienen propiedades microbidas muy buenas y que pueden emplearse para la lucha contra los microorganismos indeseados tanto en la protección de las plantas como en
15 la protección de los materiales.

Suprendentemente las difluormetiltiazolilcarboxamidas de la fórmula (I), según la invención, muestran una actividad fungicida sensiblemente mejor que la de los productos conocidos con anterioridad, similares desde el punto de vista de su constitución, con la misma dirección de actividad.

Las difluormetilthiazolilcarboxanilidas según la invención están definidas, en general, por medio de la fórmula (I).

Son preferentes las difluormetilthiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, nítro, metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, ciclopropilo, trifluorometilo, triclorometilo, trifluoretilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, difluorclorometoxi, trifluoretoxi, difluormetiltio, difluorclorometiltio o trifluormetiltio, con la condición de que R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 no signifiquen, simultáneamente, hidrógeno,

10 R^1 y R^2 o R^2 y R^3 significan, además, conjuntamente hexafluoretileno sustituido, en caso dado, por flúor, por cloro, por bromo o por metilo.

Son especialmente preferentes las difluormetilthiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

15 R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, metiltio, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, difluormetiltio o trifluormetiltio, con la condición de que R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 no signifiquen, simultáneamente, hidrógeno.

Además son muy especialmente preferentes las difluormetilthiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

20 R^1, R^2, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y R^3 tiene los significados anteriormente indicados.

Además son muy especialmente preferentes las difluormetilthiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

25 R^1, R^2, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y R^3 significa flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, trifluorometoxi o trifluormetiltio.

Además son muy especialmente preferentes las difluormetilidazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

R^1, R^2, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^3 significa ciano.

5 Además son muy especialmente preferentes las difluormetilimidazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

R^2, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^1 y R^3 tienen, independientemente entre sí, los significados anteriormente indicados.

10 Además son muy especialmente preferentes las difluormetilidazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

R^2, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^1 y R^3 significan, independientemente entre sí, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluormetilo.

15 Además son muy especialmente preferentes las difluormetilimidazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

R^1, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^3 tienen, independientemente entre sí, los significados anteriormente indicados.

20 Además son muy especialmente preferentes las difluormetilidazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

R^1, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluormetilo.

25 Además son muy especialmente preferentes las difluormetilimidazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), en la que

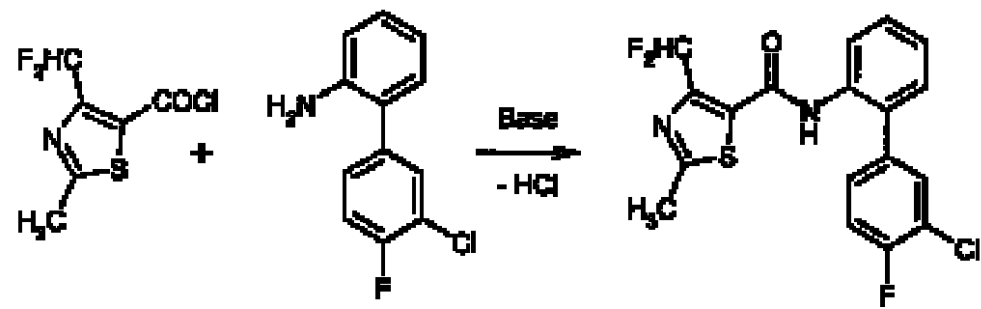
R^1, R^3 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y
 R^2 y R^4 tienen, independientemente entre si, los significados anteriormente
indicados.

Además son muy especialmente preferentes las difluormetiltiazolilcarboxanilidas
de la fórmula (I), en la que

R^1, R^3 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y
 R^2 y R^4 significan, independientemente entre sí, flúor, cloro, bromo, metilo o
trifluormetilo.

Además, son muy especialmente preferentes las difluormetiltiazolilcarboxanilidas
de la fórmula (I), en la que R^5 significa hidrógeno.

Si se emplean el cloruro de 2-metil-4-(difluorometil)-1,3-tiazol-5-carbonilo y la 3'-
cloro-4'-flúor-1,1'-bifenil-2-amina como productos de partida así como una base, podrá
representarse el desarrollo del procedimiento a), según la invención, por medio de la
ecuación de reacción siguiente:



Los halogenuros de difluormetiltiazolilcarbonilo, necesarios como productos de
partida para la realización del procedimiento a) según la invención, están definidos en
general por medio de la fórmula (II). En esta fórmula (II), preferentemente X^1 significa
cloro.

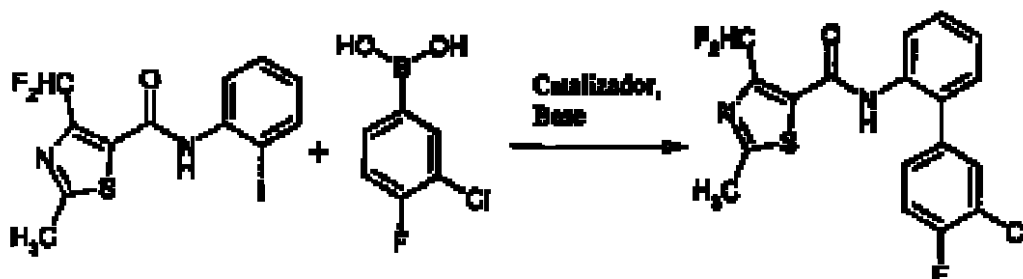
Los halogenuros de difluormetiltiazolilcarbonilo de la fórmula (II) son conocidos
y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véase por ejemplo la
publicación EP-A 0 276 177).

- 8 -

Las anilinas necesarias, además, como productos de partida para la realización del procedimiento a), según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (III). En esta fórmula (III), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen, preferentemente o bien de forma especialmente preferente, aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes o bien como especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los derivados de anilina de la fórmula (III) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véase por ejemplo las publicaciones Bull. Korean Chem. Soc. 2000, 21, 165-166; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-4; JP 09132567).

Si se emplean la *N*-(2-yodofenil)-2-metil-4-(difluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida y el ácido 3-cloro-4-fluorfenilborónico como productos de partida, así como un catalizador y una base, podrá representarse el desarrollo del procedimiento b), según la invención, por medio de la ecuación de reacción siguiente:

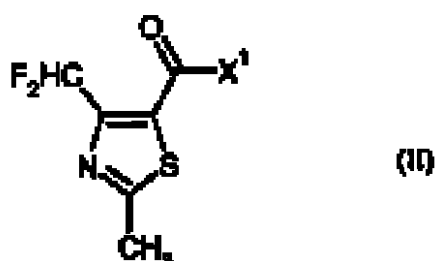


Las difluormetiltiazolcarboxihalogenoanilidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento b), según la invención, están definidas en general por medio de la fórmula (IV). En esta fórmula (IV), preferentemente X^2 significa bromo o yodo.

Las difluormetiltiazolcarboxihalogenoanilidas de la fórmula (IV) no son conocidas todavía. Éstas son compuestos químicos nuevos y forman igualmente el objeto de la presente solicitud. Éstas se obtienen, si

d) se hacen reaccionar halogenuros del ácido difluormetiltiazolcarboxílico de la fórmula

(II)



en la que

X^1 significa halógeno,

5 con 2-bromoanilina o 2-yodoanilina.

Los halogenuros del ácido difluorometiltiazolilcarboxílico de la fórmula (II), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento d), según la invención, han sido descritos ya más arriba en relación con el procedimiento a) según la invención.

10 Los productos, constituidos por la 2-bromoanilina o la 2-yodoanilina, necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento d), según la invención, son productos químicos para síntesis conocidos.

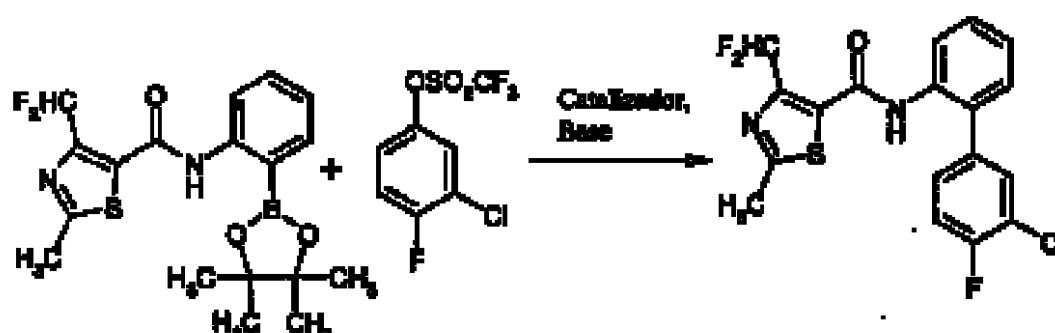
Los derivados del ácido borónico necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento b), según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (V). En esta fórmula (V), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen, 15 preferentemente o bien de forma especialmente preferente, aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes o bien como especialmente preferentes para éstos restos en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I). Preferentemente G^1 y G^2 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, 20 significan tetrametilileno.

Los derivados del ácido borónico de la fórmula (V) son productos químicos para síntesis conocidos. Éstos pueden prepararse también inmediatamente antes de la reacción,

- 10 -

directamente a partir de los derivados de halógenobenceno y de ésteres del ácido borónico y hacerse reaccionar a continuación sin aislamiento (véanse también los ejemplos de obtención).

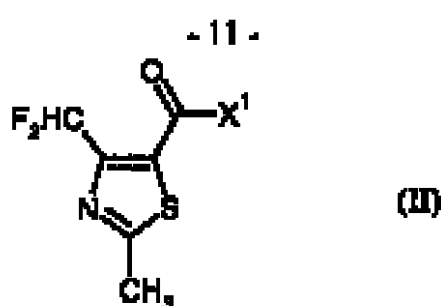
Si se emplean la 2-metil-N-[2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-4-(difluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida y el ácido 3-cloro-4-flúorfenil-trifluorometano-sulfónico como productos de partida, así como un catalizador y una base, podrá representarse el desarrollo del procedimiento c), según la invención, por medio de la ecuación de reacción siguiente:



Los derivados de la difluormetiltiazolilcarboxamida del ácido borónico, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento c), según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VI). Preferentemente en esta fórmula (VI), G³ y G⁴ significan, respectivamente, hidrógeno o conjuntamente significan tetrametileileno.

Los derivados de la difluormetiltiazolilcarboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI) no son conocidos todavía. Estos son compuestos químicos nuevos y constituyen, igualmente, el objeto de la presente solicitud. Estos se obtienen, si

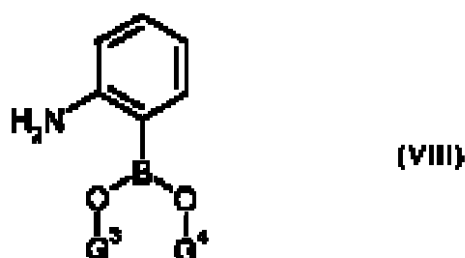
e) se hacen reaccionar halogenuros de difluormetiltiazolilcarbonilo de la fórmula (II)



en la que

X^1 significa halógeno,

con derivados del ácido anilino-borónico de la fórmula (VIII)



en la que

G^3 y G^4 tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

- 10 Los halógenuros de difluorometiltiazolilcarbonylo de la fórmula (II), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento e), según la invención, han sido descritos ya más arriba en relación con el procedimiento a) según la invención.

- 13 Los derivados del ácido anilino-borónico necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento e), según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VIII). Preferentemente, en ésta fórmula (VIII), G^3 y G^4 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametilcileno.

Los derivados del ácido anilino-borónico de la fórmula (VIII), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento e), según la invención, son productos químicos para síntesis conocidos.

Los derivados de halógenobenceno necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento c), según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VII). En esta fórmula (VII), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen, preferentemente o bien de forma especialmente preferente, aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes o bien como especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Preferentemente X^3 significa bromo, yodo o trifluorometilsulfonilo.

Como diluyentes para la realización de los procedimientos a), d) y e) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, preferentemente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados, tales como por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpírolidona o hexametilsulfotriamida.

Los procedimientos a), d) y e) según la invención se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, hidruros, hidróxidos, amidas, alcohólatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinotérreos o de metales alcalinos, tales como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc.-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de cesio, así como aminas terciarias, tales

- 13 -

como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononano (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

5 Las temperaturas de la reacción, en la realización de los procedimientos a), d) y c), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 110°C.

Para la realización del procedimiento a), según la invención, para la obtención de
10 los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol del halogenuro de difluorometiltiazolilcarbonylo de la fórmula (II), en general desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de derivado de anilina de la fórmula (III).

Para la realización del procedimiento d), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (III), se emplean, por mol del halogenuro de
15 difluorometiltiazolilcarbonylo de la fórmula (II), en general desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de 2-bromoanilina o de 2-yodoanilina.

Para la realización del procedimiento e), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (VI) se emplean, por mol del halogenuro de difluorometiltiazolilcarbonylo de la fórmula (II), en general desde 0,2 hasta 5 moles,
20 preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles del derivado del ácido anilino-borónico de la fórmula (VIII).

Como diluyentes para la realización de los procedimientos b) y c), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, preferentemente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales
25 como por ejemplo éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-

- 14 -

butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetomitrilo, propionitrilo, n- o i-butiromitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfosforotriamida; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido; sulfonas, tal como sulfolano; alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, n-, i-, sec- o terc.-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, étoxietanol, metoxietanol, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o agua pura.

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos b) y c), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 110°C.

Los procedimientos b) y c), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, fluoruros, fosfatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinotérreos o de metales alcalinos, tales como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, termbilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de cesio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilamitina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

- 15 -

Los procedimientos b) y c), según la invención, se llevan a cabo en presencia de un catalizador, tal como por ejemplo de una sal o de un complejo de paladio. En éste caso entran en consideración, preferentemente, cloruro de paladio, acetato de paladio, tetrakis(trifenilfosfina)-paladio, cloruro de bis-(trifenilfosfina)-paladio o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocenopaladio(II).

También puede generarse un complejo de paladio en la mezcla de la reacción, si se añaden separadamente a la reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal como por ejemplo trifenilfosfano, tri-*tert*-butilfosfano, triciclohexilfosfano, 2-(díciclohexilfosfano)-bifenilo, 2-(di-*tert*-butilfosfano)-bifenilo, 2-(díciclohexilfosfano)-2'-(*N,N*-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfano, tris-(*o*-tolil)-fosfano, 3-(difenilfosfino)benzenosulfonato de sodio, tris-2-(*metoxifenil*)-fosfano, 2,2'-bis-(difenilfosfano)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis(difenilfosfano)-butano, 1,2-bis-(difenilfosfano)-etano, 1,4-bis-(díciclohexilfosfano)-butano, 1,2-bis-(díciclohexilfosfano)-etano, 2-(díciclohexilfosfano)-2'-(*N,N*-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno o tris-(2,4-*tert*-butilfenil)-fosfito.

Para la realización del procedimiento b), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la difórmictiazolilcarboxihalogenoamida de la fórmula (IV), en general desde 1 hasta 15 moles, preferentemente desde 2 hasta 8 moles del derivado del ácido borónico de la fórmula (V).

Para la realización del procedimiento c), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se emplean, por mol del derivado de la difórmictiazolilcarboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI), en general desde 1 hasta 15 moles, preferentemente desde 2 hasta 8 moles de derivado de halógenobenceno de la fórmula (VII).

Los procedimientos a), b), c) y d), según la invención, se llevan a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también trabajar bajo presión más elevada o a

- 16 -

presión más reducida —en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares—.

Los productos según la invención presentan un potente efecto microbicida y pueden emplearse en la práctica para combatir microorganismos indeseados, tales como hongos y bacterias, en la protección de las plantas y en la protección de los materiales.

5 Los agentes fungicidas pueden emplearse para la lucha contra los plasmodiomicetes, oomicetes, quitridiomicetes, cigomicetes, ascomicetes, basidiomicetes, deuteromicetes.

10 Los agentes bactericidas pueden emplearse en la protección de las plantas para combatir pseudomonádaceos, rizobiáceos, enterobacteriáceos, corinebacteriáceos y estreptomicetáceos.

Pueden citarse a modo de ejemplo, pero sin ningún carácter limitativo, algunos patógenos de enfermedades fúngicas y bacterianas, que entran dentro de las definiciones generales anteriormente enumeradas:

- tipos de xantomonas, tales como por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
- 15 tipos pseudomonas, tales como por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lactrymans*;
- tipos de erwinia, tales como por ejemplo *Erwinia amylovora*;
- tipos de pitium, tal como por ejemplo *Pythium ultimum*;
- tipos de fitoflora, tal como por ejemplo *Phytophthora infestans*;
- tipos de pseudoperonospora, tales como por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o
- 20 *Pseudoperonospora cubensis*;
- tipos de plasmapara, tal como por ejemplo *Plasmapara viticola*;
- tipos de bremia, tal como por ejemplo *Bremia lactucae*;
- tipos de peronospora, tales como por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
- tipos de erisífe, tal como por ejemplo *Erysiphe graminis*;
- 25 tipos de sfæroteca, tal como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*;
- tipos de podosfera, tal como por ejemplo *Podosphaera leucotricha*;

tipos de venturia, tal como por ejemplo *Venturia inaequalis*;

tipos de pirrenofora, tal como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *P. graminea*;

(forma de conidias, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);

tipos de coeliobolus, tal como por ejemplo *Cochliobolus sativus*

9 (forma de conideas, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);

tipos de tromyces, tal como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;

tipos de puccinia, tal como por ejemplo *Puccinia recondita*;

Tipos de esclerotinia, tal como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*;

tipos de tilletia, tal como por ejemplo *Tilletia caries*;

10 tipos de ustilago, tal como por ejemplo *Ustilago tritici* o *Ustilago avenae*;

tipos de pelicularia, tal como por ejemplo *Pellicularia sasakii*;

tipos de piricularia, tal como por ejemplo *Pyricularia oryzae*;

tipos de fusario, tal como por ejemplo *Fusarium culmorum*;

tipos de botrytis, tal como por ejemplo *Botrytis cinerea*;

15 tipos de septoria, tal como por ejemplo *Septoria nodorum*;

tipos de leptosphaeria, tal como por ejemplo *Leptosphaeria nodorum*;

tipos de cercospora, tal como por ejemplo *Cercospora canescens*;

tipos de alternaria, tal como por ejemplo *Alternaria brassicae*;

tipos de pseudocercosporia, tal como por ejemplo *Pseudocercospora herpotrichoides*.

20 Los productos activos según la invención presentan, también, un potente efecto reforzador en las plantas. Son adecuados por lo tanto para movilizar las autodefensas vegetales contra el ataque debido a los microorganismos indeseados.

Se entenderán en este contexto por productos reforzadores de los vegetales (inductores de resistencia) aquellas sustancias que sean capaces de estimular el sistema
25 Inmune de las plantas de tal manera que las plantas tratadas desarrollen una amplia resistencia contra los microorganismos indeseados, cuando se produzca una inoculación

subsiguiente con estos microorganismos.

Por microorganismos indicados se entenderán en el caso presente hongos, bacterias y virus fitopatógenos. Los productos según la invención pueden emplearse, por lo tanto, para proteger a las plantas contra el ataque provocado por los patógenos citados en el transcurso de un cierto intervalo de tiempo desde el tratamiento. El intervalo de tiempo, dentro del cual se provoca la protección, se extiende, en general, desde 1 hasta 10 días, preferentemente desde 1 hasta 7 días desde el tratamiento de las plantas con los productos activos.

La buena compatibilidad con las plantas y los productos activos a las concentraciones necesarias para la lucha contra las enfermedades de las plantas permite un tratamiento de las partes aéreas de las plantas, de plántones y semillas y del suelo.

Los productos activos son adecuados también para aumentar el rendimiento de las cosechas. Además son de baja toxicidad y presentan una buena compatibilidad para con las plantas.

Los productos activos según la invención pueden emplearse en caso dado, en determinadas concentraciones y cantidades de aplicación, también como herbicidas, para influenciar el crecimiento de las plantas, así como para la lucha contra las plagas animales. Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios y como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del

derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos, aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plántones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo de forma directa o por acción sobre el medio ambiente, el biotopo o el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

En la protección de los materiales pueden emplearse los productos según la invención para la protección de materiales industriales contra el ataque y la destrucción provocados por los microorganismos indeseados.

Se entenderán por materiales industriales en el presente contexto materiales no-vivos, que hayan sido preparados para el empleo en la industria. De manera ejemplificativa los materiales industriales, que deben ser protegidos por medio de los productos activos según la invención contra las modificaciones o la destrucción bacteriana, son pegamentos, colas, papel y cartón, textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de materiales sintéticos, lubricantes para refrigeración y otros materiales, que pueden ser atacados o destruidos por los microorganismos. En el ámbito de los materiales a ser protegidos pueden citarse también partes de instalaciones de producción, por ejemplo circuitos cerrados de agua de refrigeración, que pueden ser perjudicados por la multiplicación de los microorganismos. En el ámbito de la presente invención pueden citarse como materiales industriales preferentemente pegamentos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, pinturas,

- 20 -

lubrificantes para refrigeración y líquidos caloportadores, de forma especialmente preferente la madera.

Como microorganismos, que pueden provocar la descomposición o la modificación de los materiales industriales, pueden citarse a modo de ejemplos bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. Preferentemente los productos activos según la invención actúan contra hongos, especialmente contra mohos, hongos coloradores y destructores de la madera (basidiomycetos) así como contra organismos mucilaginosos y algas.

A modo de ejemplo pueden citarse los microorganismos de los tipos siguientes:

- 10 Alternaria, tal como *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, tal como *Aspergillus niger*,
Chaetomium, tal como *Chaetomium globosum*,
Coniophora, tal como *Coniophora puteana*,
Lentinus, tal como *Lentinus tigrinus*,
- 15 Penicillium, tal como *Penicillium glaucum*,
Polyporus, tal como *Polyporus versicolor*,
Aureobasidium, tal como *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, tal como *Sclerophoma pityophila*,
Trichoderma, tal como *Trichoderma viride*,
- 20 Escherichia, tal como *Escherichia coli*,
Pseudomonas, tal como *Pseudomonas aeruginosa*,
Staphylococcus, tal como *Staphylococcus aureus*.

Los productos activos se transformarán, en función de sus propiedades respectivas físicas y/o químicas, en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, granulados, aerosoles, microencapsulados en materiales poliméricos y en masas de recubrimiento para semillas, así como en

formulaciones de nebulizado en frío y en caliente de volumen ultra bajo (ULV).

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo mediante
mezclado de los compuestos activos con extendedores, es decir, con disolventes líquidos,
gases licuados bajo presión y/o excipientes sólidos, en caso dado con empleo de agentes
5 tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.
Cuando se emplea agua como extendedor, se pueden utilizar disolventes orgánicos, por
ejemplo, como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración
preferentemente: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno, o
alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos
10 clorados, tales como los clorobencenos, clorotilchenos o cloruro de metileno, los
hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las fracciones
de petróleo, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus éteres y ésteres, las
cetonas, tales como acetona, metilcetilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, o los
disolventes fuertemente polares, tales como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así
15 como el agua; por extendedores o excipientes gaseosos licuados se entienden aquellos
líquidos que son gaseosos a temperatura y presión normales, por ejemplo gases de
propulsión para aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, así como butano,
propano, nitrógeno y dióxido de carbono; como excipientes sólidos pueden emplearse los
minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo,
20 attapulgita, montmorillonita o tierra de diatomáceas y los minerales sintéticos molidos, tal
como ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio y silicatos; como
excipientes sólidos para granulados pueden emplearse los minerales naturales quebrados y
fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, apolita y dolomita, así como los
granulados sintéticos de barinas inorgánicas y orgánicas y granulados de material orgánico,
25 tales como semillas, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como
emulsionantes y/o espurantes entran en consideración, por ejemplo, emulsionantes no

- 22 -

ionógenos y aniónicos, tales como los ésteres polioxi-etilenados de los ácidos grasos, los ésteres polioxi-etilenados de los alcoholes grasos, por ejemplo, el alquilari(poliglicol)éter, los alquilsulfonatos, los alquilsulfatos, los arilsulfonatos así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración las lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos, tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo, así como fosfolípidos, tal como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales o vegetales.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azóicos y de ftalocianina metálicos así como nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 % de producto activo.

Los productos activos según la invención pueden emplearse como tales o en sus formulaciones incluso en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas como para ampliar así el espectro de actividad o para vencer desarrollos de resistencia. En muchos casos se obtienen de este modo efectos sinérgicos, es decir que la actividad de la mezcla es mayor que las actividades de los componentes individuales.

Como componentes de mezcla entran en consideración los compuestos siguientes:

Fungicidas:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-potasio, Andoprín, Arilazin, Azaconazol, Azoxystrobin, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacríl, Benzamacríl-isobutílo, Bialaphos,

- Binapacryl, Biphenyl, Biteranol, Elasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Bulthiobat, polisulfuro de calcio, Carpropamid, Capdmycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlofenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropierin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb,
- 5 Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Dicleofuanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 10 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etoconazol, Ethirimol, Etridiazol, Farnoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenhexamid, Fenitropan, Fenpicloril, Fenpropidin, Fenprolmorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimxon, Fluzianon, Flumetover, Fluoruxid, Fluxquinconazol, Flurprimidol, Flusllazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutrialfol, Falpet, Fosetyl-Aluminio, Fosetyl-sodio, Fthalid,
- 15 Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumecyclox, Guazutin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealberilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipreconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Iprovalicarb, Iromamycin, Isoprothiolan,
- 20 Isovaledione, Kasugamycin, Kresoxim-metilo, preparaciones de cobre, tales como: hidróxido de cobre, naitenato de cobre, oxícloruro de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina de cobre y mezcla de Bordeaux, Mancopper, Mancozeb, Maneb, Metconazonc, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl,
- 25 Metconazol, Methasulfocarb, Methfuraxam, Metiram, Metomeclan, Metsulfosax, Mikliomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

- dimetilditiocarbamato de níquel, Nitrothal-isopropilo, Nuarimol,
 Olumec, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthim,
 Paclobutrazol, Pefurazoxi, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricoin,
 Piperidin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb,
 5 Propanosine-sodio, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifeno, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
 Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen,
 azufre y preparaciones de azufre, Spiroxamine,
 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecrazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen,
 10 Thifluzamide, Thiophanate-metilo, Thiram, Tikoxymid, Tolclofos-metilo, Tolyflumid,
 Triadimefon, Triadimenol, Triazbudl, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph,
 Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
 Uniconazol, Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
 Zarikamid, Zineb, Ziram así como
 15 Dagger G, OK-8705, OK-8801,
 α -(1,1-dimetiletil)- β -(2-fenoxietil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
 α -(2,4-diclorofenil)- β -flúor-b-propil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
 α -(2,4-diclorofenil)- β -metoxi-a-metil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
 α -(5-metil-1,3-dioxan-5-il)- β -[[4-(trifluormetil)-fenil]-metileo]-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
 20 (5RS,6RS)-6-hidroxi-2,2,7,7-tetrametil-5-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-3-octanona,
 (E)- α -(metoxiimino)-N-metil-2-fenoxi-fenilacetamida,
 carbamato de {2-metil-1-[[[1-(4-metilfenil)-etil]-amino]-carbonil]-propil}-1-isopro-pilo,
 1-(2,4-diclorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-ctanon-O-(fenilmetil)-oxima,
 1-(2-metil-1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona,
 25 1-(3,5-diclorofenil)-3-(2-propenil)-2,5-pirrolidindiona,

- 25 -

- 1-[(dihydometil)-sulfonil]-4-metil-benceno,
 1-[[2-(2,4-diclorofenil)-1,3-dioxolan-2-il]-metil]-1H-imidazol,
 1-[[2-(4-clorofenil)-3-feniloxirani]-metil]-1H-1,2,4-triazol,
 1-[1-[2-[(2,4-diclorofenil)-metoxi]-fenil]-etenil]-1H-imidazol,
 5 1-metil-5-nonil-2-(fenilmetil)-3-pirrolidinol,
 2',6'-dibromo-2-metil-4'-trifluorometoxi-4'-trifluor-metil-1,3-tiazol-5-carboxamida,
 2,6-dicloro-5-(metiltio)-4-pirimidinil-tiocianato,
 2,6-dicloro-N-(4-trifluorometilbencil)-benzamida,
 2,6-dicloro-N-[[4-(trifluorometil)-fencil]-metil]-benzamida,
 10 2-(2,3,3-triyodo-2-propenil)-2H-tetrazol,
 2-[(1-metiltio)-sulfonil]-5-(triclorometil)-1,3,4-tiadiazol,
 2-[[6-deoxi-4-O-(4-O-metil-β-D-glucopiranosil)-α-D-glucopiranosil]-amino]-4-metoxi-1H-
 pirulo[2,3-d]pirimidin-5-carbonitrilo,
 2-aminobutano,
 13 2-bromo-2-(bromometil)-pentandinitrilo,
 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida,
 2-cloro-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(isodocicetometil)-acetamida,
 2-fenilfenol(OPP),
 3,4-dicloro-1-[4-(difluorometoxi)-fencil]-1H-pirrol-2,5-diona,
 20 3,5-dicloro-N-[cian[(1-metil-2-propinil)-oxi]-metil]-benzamida,
 3-(1,1-dimetilpropil)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitrilo,
 3-[2-(4-clorofenil)-5-etoxi-3-isoxazolidinil]-piridina,
 4-cloro-2-cian-N,N-dimetil-5-(4-metilfenil)-1H-imidazol-1-sulfonamida,
 4-metil-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 24 8-hidroxiquinolinsulfato,
 2-[(fenilamino)-carbonil]-hidrazida del ácido 9H-murco-9-carboxílico,

- 26 -

- bis-(1-metiletil)-3-metil-4-[(3-metilbenzoi)-oxi]-2,5-tiofendicarboxilato,
 cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol,
 hidrocioruro de cis-4-[3-[4-(1,1-dimetilpropil)-fenil-2-metilpropil]-2,6-dimetil-morfo-lina,
 [(4-clorofenil)-azo]-cianacetato de etilo,
- 5 bicarbonato de potasio,
 metanotetrasil-sal sódica,
 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imida-zol-5-carboxilato de metilo,
 N-(2,6-dimetilfenil)-N-(5-isoxazolilcarbomil)-DL-alaninato de metilo,
 N-(cloroacetil)-N-(2,6-dimetilfenil)-DL-alaninato de metilo,
- 10 N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-furanil)-acetamida,
 N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-tienil)-acetamida,
 N-(2-cloro-4-nitrofenil)-4-metil-3-nitro-bencenosulfonamida,
 N-(4-ciclohexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-piridinamina,
 N-(4-benzilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-piridinamina,
- 15 N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-metoxi-N-(2-oxo-3-oxazolidinil)-acetamida,
 N-(6-metoxi)-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida,
 N-[2,2,2-tricloro-1-[(cloroacetil)-amino]-etil]-benzamida,
 N-[3-cloro-4,5-bis-(2-propiniloxi)-fenil]-N'-metoxi-metan-imidamida,
 N-formil-N-hidroxi-DL-alanina, sal sódica
- 20 [2-(diisopropilamino)-2-oxoetil]-sulfosforamidato de O,O-dietilo,
 isopropilfosforamidato de O-metilo-S-fenilo,
 1,2,3-benzotiadiazol-7-carbotioato de S-metilo,
 spiru[2H]-1-benzopirran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-ona,
 4-[(3,4-dimetoxifenil)-3-(4-flúorfenil)-acriloil]-morfolina,
- 25 **Bactericidas:**
 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbato de níquel, Kasugamycin,

- 27 -

Oethillnon, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclín, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

- Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,
 5 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,
 Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb,
 Bensulap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin,
 10 Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos,
 Butocarboxim, Butylpyridaben,
 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb,
 Chlorethoxyfos, Chlorfenvap, Chlorfenvinphos, Chlorfenzuron, Chlormephos,
 Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin,
 15 Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos,
 Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin,
 Cyromazine,
 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Dlafenthuron, Diazinon,
 Dichlorvos, Dicosol, Dislubenuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diufenolan,
 20 Disulfoton, Docusat-sodio, Dofenapyn,
 Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopillhona spp., Esfenvalerate,
 Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrinifos,
 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxido, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrin,
 Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate,
 25 Fipronil, Fluazuron, Flubrocycrinat, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron,
 Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox,

- 28 -

- Furathiocarb,
granulovirus,
Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,
5 poliédrovirus nucleares, Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
Malathion, Mccarbam, Metaldéhyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,
Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazona, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin,
Monocrotophos,
10 Naled, Nitropyram, Nithiazine, Novaluron, Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M,
Puccinomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenhoat, Phorat,
Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M,
Profenofos, Promcarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine,
Pyraclofos, Pyreanethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen,
15 Pyriproxyfen, Quinalphos, Ribavirin,
Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,
Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,
Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Theta-
cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thioacylam
20 hydrogeno oxalato, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,
Triarathene, Triazamatc, Triazophos, Triazuron, Trichlophendime, Trichlorfon,
Triflummuron, Trimethacarb,
Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii,
YI 5302, Zeta-cypermethrin, Zoluprofos
25 (1R-cis)-[5-(fenilmesil)-3-furamil]-metil-3-[(dihidro-2-oxo-3(2H)-furaniliden)-metil]-2,2-
dimetilciclopropanocarboxilato

- 29 -

- (3-fenoxifenil)-metil-2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato
- 1-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]tetrahidro-3,5-dimetil-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imina
- 2-(2-cloro-6-fluorfenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol
- 2-(acetiloxi)-3-dodecil-1,4-naftalindiona
- 5 2-cloro-N-[[4-(1-fenilctoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida
- 2-cloro-N-[[4-(2,2-dicloro-1,1-difluorctoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida
- 3-metilfenil-propilcarbamato
- 4-[4-(4-etoxifenil)-4-metilpenil]-1-fluor-2-fenoxi-benceno
- 4-cloro-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxifenoxi)etil]tio]-3(2H)-piridazinona
- 10 4-cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-[(6-yodo-3-piridinil)metoxi]-3(2H)-piridazinona
- 4-cloro-5-[(6-cloro-3-piridinil)metoxi]-2-(3,4-diclorofenil)-3(2H)-piridazinona
- Bacillus thuringiensis* cepa BG-2348
- [2-benzoi-1-(1,1-dimetil)-hidrazida del ácido benzoico
- butanoato de 2,2-dimetil-3-(2,4-diclorofenil)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo
- 15 [3-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-tiazolidiniliden]-cianamida
- dihidro-2-(nitrometilén)-2H-1,3-tiazina-3(4H)-carboxaldehido
- [2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]oxi]etil]-carbamato de etilo
- N-(3,4,4-trifluor-1-oxo-3-butenil)-glicina
- N-(4-clorofenil)-3-[4-(difluorometoxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1H-pirazol-1-carboxamida
- 20 N-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]-N'-metil-N''-nitroguanida
- N-metil-N'-(1-metil-2-propenil)-1,2-hidrazindicarbotioamida
- N-metil-N'-2-propenil-1,2-hidrazindicarbotioamida
- [2-(diisopropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforoamidato de O,O-dietilo
- N-cianometil-4-trifluorometil-nicotinamida
- 25 3,5-dicloro-1-(3,3-dicloro-2-propeniloxi)-4-[3-(5-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-propoxi]-benceno.

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales como herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento.

Además los compuestos según la invención, de la fórmula (I) presentan también buenos efectos antimicóticos. Estos tienen un espectro de actividad antimicótico muy
5 amplio, especialmente contra dermatofitos y blastomicetos, mohos y hongos difusos (por ejemplo contra especies de candida tales como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) así como *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus* tales como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de micofiton tal como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de microsporion tales como *Microsporion canis* y *audouinii*. La enumeración de
10 estos hongos no significa en modo alguno una delimitación del espectro micótico abarcada, sino que únicamente tienen carácter explicativo.

Los productos activos pueden emplearse como tales en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de las anteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, polvos inyectables, pastas, polvos solubles, agentes de
15 espolvoreo y granulados. El empleo se efectúa de forma usual, por ejemplo por regado, pulverizado, espolvoreado, esparcido, empolvado, espumado, aplicación a brocha etc. En caso dado se aplicaran los productos activos también según el procedimiento de volumen ultra bajo o la preparación de producto activo o el propio producto activo se inyectarán en el suelo. También pueden tratarse las semillas de las plantas.

20 Cuando se emplean los productos activos según la invención como fungicidas, las cantidades de aplicación pueden variar, según la forma de aplicación, dentro de un gran intervalo. Cuando se tratan partes de las plantas las cantidades de aplicación del producto activo puede variar en general entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 10 y 1.000 g/ha. En el caso del tratamiento de las semillas las cantidades de aplicación de producto
25 activo se encuentran comprendidas, en general, entre 0,001 hasta 50 g por cada kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 hasta 10 g por kilogramo de semillas. Cuando se

trata el suelo las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran comprendidas, en general entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 1 y 5.000 g/ha.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por métodos de cultivo biológicos convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma preferente de realización se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que hayan sido obtenidas según métodos de ingeniería genética en caso dado en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. La expresión "partes" o bien "partes de plantas" o "componentes de plantas" ha sido anteriormente explicada

De forma especialmente preferente se tratan plantas, según la invención, de las variedades de plantas usuales en el mercado o que se encuentran en utilización. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("características"), que se han cultivado tanto por medio de cultivo convencional, como por mutagenesis o por técnicas recombinantes de DNA. Estas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, período de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobresensitivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los productos empleables según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de

almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados, que van mas allá del efecto esperable propiamente dicho.

A las plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) a ser tratadas según la invención, pertenecen todas las plantas, que han adquirido material genético mediante modificación por ingeniería genética, que proporcionan a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("características"). Ejemplos de tales propiedades son, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados. Otros ejemplos, especialmente señalables para tales propiedades son la mayor resistencia de las plantas frente a las plagas animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza así como plantaciones de frutales (con los frutos manzana, pera, cítricos y uva), debiéndose señalar especialmente maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("características") se señalará especialmente la mayor resistencia de las plantas frente a los insectos por medio de las toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como por sus combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") deben señalarse además,

- 33 -

especialmente, la mayor resistencia de las plantas frente a los hongos, las bacterias y los virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientes. Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor

5 tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotricin (por ejemplo gen "PAT"). Los genes que proporcionan las respectivas propiedades ("características") deseadas pueden estar presentes también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt" pueden citarse variedades de maíz, variedades de

10 algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan bajo las marcas registradas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nuotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes de los herbicidas pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se

15 comercializan bajo las marcas registradas Roundup Ready® (tolerancia contra Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinotricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS® (tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas)

20 pueden citarse también las variedades comercializadas para la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o bien que se comercialicen o se desarrollen en el futuro con estas propiedades genéticas ("características").

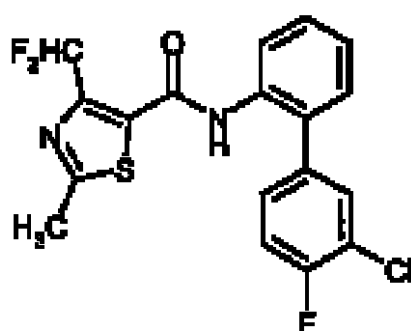
25 Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la

- 34 -

invención con los compuestos de la fórmula general (I) o bien de las mezclas de los productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las
5 plantas con los compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el presente texto.

Ejemplos de obtención

Ejemplo 1



10 Procedimiento a)

Se disuelven 0,288 g (1,3 mmol) de la 3'-cloro-4'-flúor-1,1'-bifenil-2-amina y 0,33 g (1,5 mmol) del cloruro de 2-metil-4-(difluorometil)-1,3-tiazol-5-carbonilo en 6 ml de tetrahidrofurano y se combinan con 0,36 ml (2,6 mmol) de trietilamina. La solución de la reacción se agita durante 16 h a 60°C. Para el aislamiento se concentra y se
15 cromatografía con ciclohexano/acetato de etilo sobre gcl de sílice.

Se obtienen 0,434 g (84 % de la teoría) de la *N*-(3'-cloro-4'-flúor-1,1'-bifenil-2-yl)-2-metil-4-(difluorometil)-1,3-tiazol-5-carboxamida con el logP (pH2,3) = 3,28.

De manera análoga a la del ejemplo 1, así como de acuerdo con las indicaciones dadas en las descripciones generales de los procedimientos a) y b), se obtienen los
20 compuestos de la fórmula (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

- 35 -

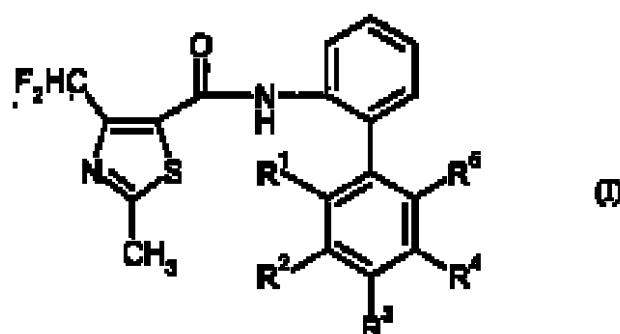


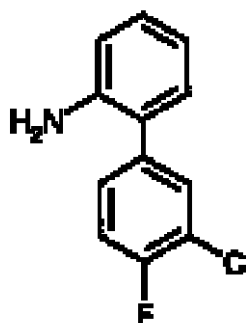
Tabla I

Ejempl.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	logP
2	H	H	Br	H	H	3,47
3	H	H	CF ₃	H	H	3,52
4	H	Cl	H	H	H	3,37
5	H	H	OCF ₃	H	H	3,72
6	H	H	SCH ₃	H	H	3,39
7	H	H	F	H	H	3,09
8	H	Cl	Cl	H	H	3,58
9	Cl	H	Cl	H	H	3,58
10	CH ₃	H	Cl	H	H	3,77
11	H	F	Cl	H	H	3,29
12	H	Cl	CH ₃	H	H	3,62
13	F	H	Cl	H	H	3,26
14	H	F	H	Cl	H	3,36
15	F	H	Br	H	H	3,34
16	H	CH ₃	Cl	H	H	3,66
17	H	Cl	H	Cl	H	3,7
18	H	F	H	F	H	3,07
19	H	CF ₃	Cl	H	H	3,66
20	H	F	F	H	H	3,04
21	H	H	Cl	H	H	3,27
22	H	F	Br	H	H	3,36
23	H	F	CF ₃	H	H	3,43
24	F	H	F	H	H	2,93
25	H	H	CN	H	H	2,51
26	H	H	H	H	H	3,50

4 Obtención del producto de partida de la fórmula (III)

Ejemplo (III-1)

- 36 -



Se disuelven 38,8 g (233 mmol) del ácido 3-cloro-4-fluorfenilborónico, 40,6 g (186 mmol) de 2-yodoanilina en 220 ml de tolueno, 22 ml de etanol y 45 ml de una disolución 4 M de bicarbonato de sodio, bajo argón. Se añaden 4,3 g (4 mmol) de tetraakis(trifenilfosfina)paladio(0) y se agita la solución de la reacción durante 16 h a 80°C bajo argón. La fase orgánica se separa, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra. El residuo se cromatografía con ciclohexano/acetato de etilo sobre gel de sílice.

Se obtienen 22,5 g (48 % de la teoría) de la 3'-cloro-4'-flúor-1,1'-bifenil-2-amina (pureza 88 %), con el logP (pH2,3) = 3,01.

La determinación de los valores logP, indicados en las tablas precedentes y en los ejemplos de obtención, se lleva a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A.8 mediante HPLC (High Performance Liquid Chromatography (cromatografía líquida de alta resolución)) sobre una columna con inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

La determinación se lleva a cabo en el intervalo ácido a pH 2,3 con ácido fosfónico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo.

El calibrado se lleva a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores lambda máximos se determinaron por medio de espectros UV desde 200 nm hasta 400 nm, en los máximos de las señales cromatográficas.

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

5 Ensayo con *Venturia* (manzano) / protector.

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

Emulsionante: 1,0 Parte en peso alquil-aril-poliglicoléter.

10 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en las cantidades de aplicación indicadas. Tras secado del revestimiento aplicado por pulverización se inoculan las plantas con una suspensión 15 acuosa de conidios del patógeno de la antracnosis del manzano *Venturia inaequalis* y permanecen, a continuación 1 día aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

Las plantas se disponen, a continuación, en el invernadero aproximadamente a 21°C y con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 90 %.

20 La evaluación se realiza a 1 cabo de 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se observa ataque.

Tabla A:**Ensayo con Venturia (Manzano) / protector**

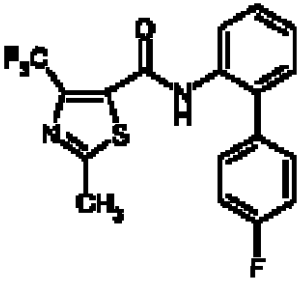
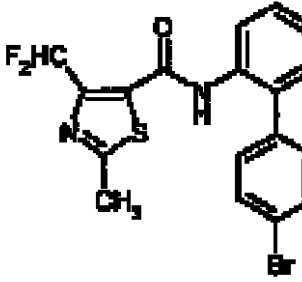
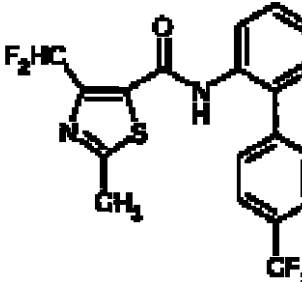
Ejemplo	Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
<u>Según la EP-A 0 543 099:</u>			
3.37		10	32
<u>Según la invención:</u>			
2		10	100
3		10	100

Tabla A:**Ensayo con *Venturia* (Manzano) / protector**

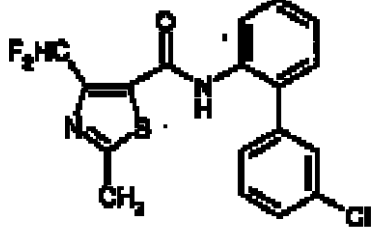
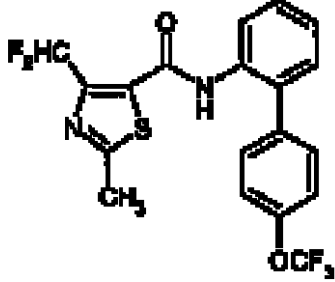
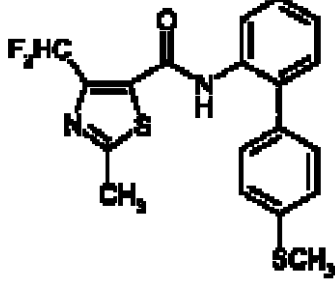
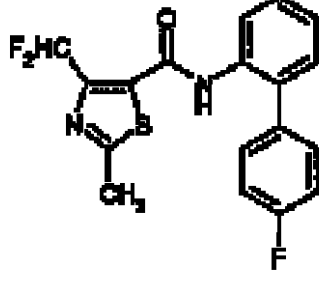
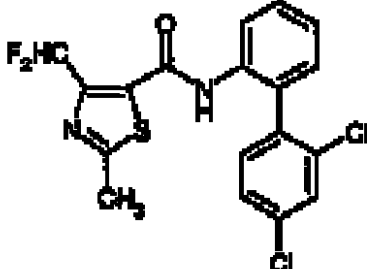
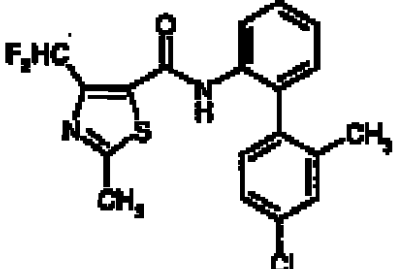
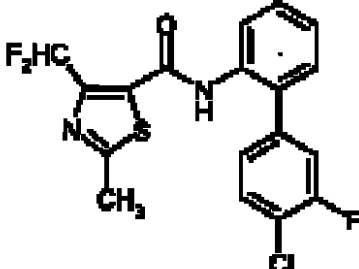
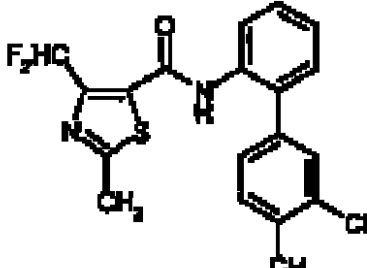
Ejemplo	Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
4		10	100
5		10	87
6		10	99
7		10	100

Tabla A1 Ensayo con Venturia (Manzano) / protector			
Ejemplo	Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
9		10	98
10		10	100
11		10	100
12		10	100

Ejemplo B

Ensayo con *Botrytis* (Judías) / protector

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

3 **Emulsionante:** 1,0 Parte en peso alquil-aril-políglícoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

10 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en las cantidades de aplicación indicadas. Tras secado del revestimiento aplicarlo por pulverización se disponen sobre cada hoja 2 trozos pequeños de agar cubiertos de *Botrytis cinerea*. Las plantas inoculadas se disponen en una cámara oscurecida aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 %.

15 Se evalúa, al cabo de 2 días desde la inoculación, el tamaño de las manchas provocadas por el ataque sobre las hojas. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se observa ataque.

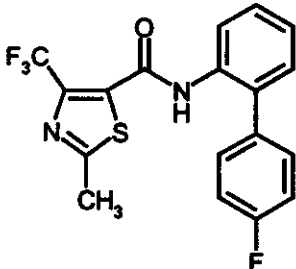
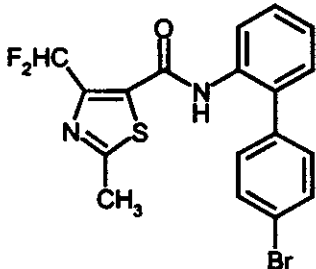
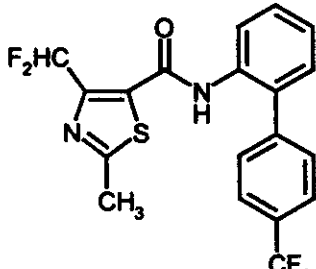
Tabla B:			
Ensayo con Botrytis (judías) / protector			
Ejemplo	Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
<u>según la EP-A 0 545 099:</u>			
3.37		100	50
<u>Según la invención:</u>			
2		100	100
3		100	100

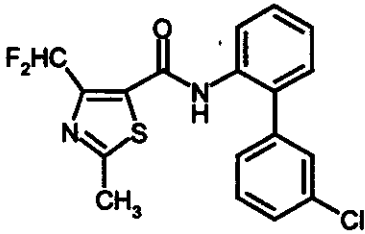
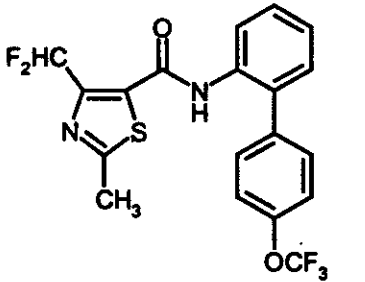
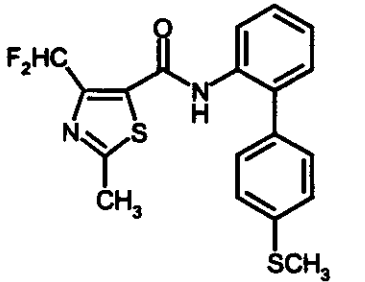
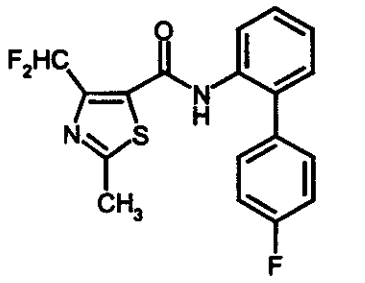
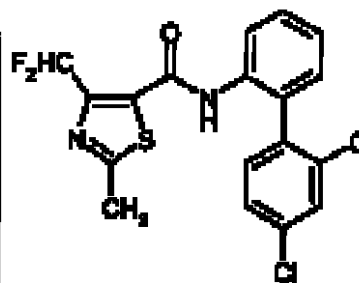
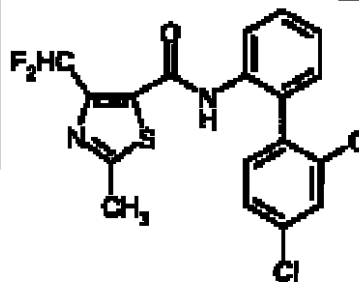
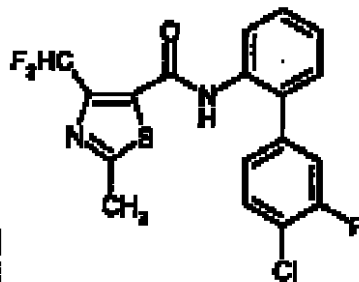
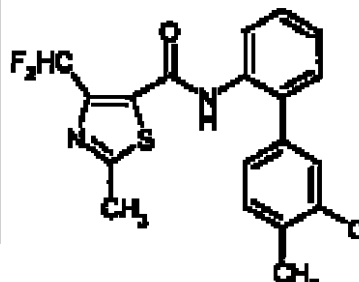
Tabla B:			
Ensayo con Botrytis (judías) / protector			
Ejemplo	Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
4	 <chem>Cc1nc(C(F)F)s(C(=O)Nc2ccccc2-c3ccc(Cl)cc3)c1</chem>	100	100
5	 <chem>Cc1nc(C(F)F)s(C(=O)Nc2ccccc2-c3ccc(OC(F)(F)F)cc3)c1</chem>	100	79
6	 <chem>Cc1nc(C(F)F)s(C(=O)Nc2ccccc2-c3ccc(SC)cc3)c1</chem>	100	94
7	 <chem>Cc1nc(C(F)F)s(C(=O)Nc2ccccc2-c3ccc(F)cc3)c1</chem>	100	94

Tabla B: Ensayo con Botrytis (judías) / protector			
Ejemplo	Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
9		100	95
10		100	100
11		100	100
12		100	100

Ejemplo C**Ensayo in vitro para la determinación de ED₅₀ con microorganismos**

Se pipeta una solución metanólica del producto activo a ser ensayado en las cavidades de placas de microtitulación, en combinación con el emulsionante P916. Una vez que se ha evaporado el disolvente, se añaden, en cada cavidad, 200 µl de medio de dextrosa de patata.

El medio había sido combinado, previamente, con una concentración adecuada de esporas o bien de micelio del hongo a ser ensayado.

Las concentraciones resultantes del producto activo eran 0,1, 1, 10 y 100 ppm. La concentración resultante del emulsionante era de 300 ppm.

Las placas se incuban, a continuación, durante 3-5 días en una mesa sacudidora a una temperatura de 22°C hasta que pueda ser detectado un crecimiento suficiente en los controles no tratados.

La evaluación se verifica por fotometría con una longitud de onda de 620 nm. A partir de los datos de medición de las diversas concentraciones se calcula la dosis de producto activo, que conduce a una inhibición del 50 % del crecimiento fúngico frente a los controles no tratados (ED₅₀).

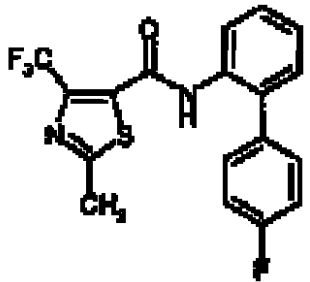
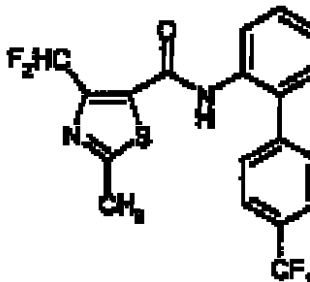
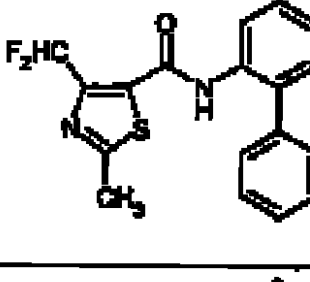
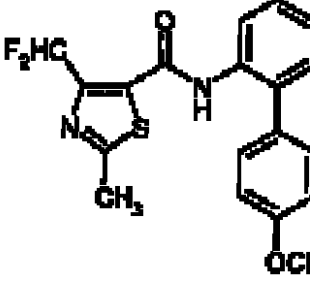
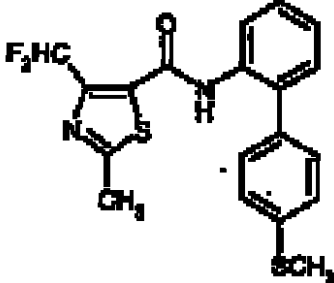
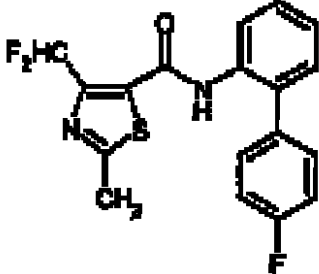
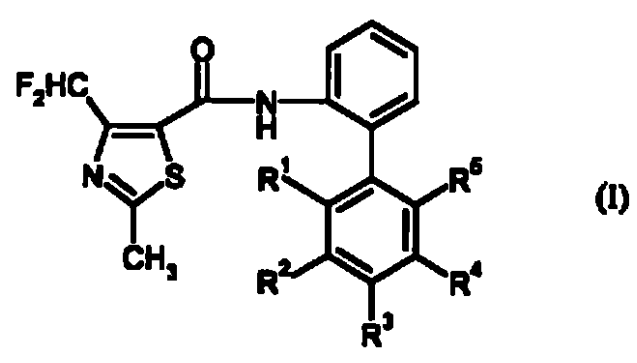
Tabla C:			
Ensayo in vitro Para la determinación de ED ₅₀ con microorganismos			
Ejemplo	Producto activo	Microorganismo	Valor ED ₅₀
Según la EP-A 0 545 099:			
3.37		Rhizoctonia solani Septoria tritici	> 100 84,24
Según la invención:			
3		Rhizoctonia solani Septoria tritici	< 0,1 0,36
4		Rhizoctonia solani Septoria tritici	< 0,1 0,45
5		Rhizoctonia solani Septoria tritici	< 0,1 0,25

Tabla C: Ensayo in vitro Para la determinación de ED₅₀ con microorganismos			
Ejemplo	Producto activo	Microorganismo	Valor ED ₅₀
6		Rhizoctonia solani Septoria tritici	3,25 3,51
7		Rhizoctonia solani Septoria tritici	0,48 0,68

REIVINDICACIONES

1.- Difluormetiltiazolilcarboxanilidas de la formula (I)



en la que

5 R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, o significa halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi
10 con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, con la condición de que R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ no signifiquen simultáneamente hidrógeno,

15 R¹ y R² o R² y R³ significan, además, conjuntamente alquenileno substituido, en caso dado, por halógeno o por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

2.- Difluormetiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1,

en la que

20 R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, ciclopropilo, trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, difluormetoxi, trifluormetoxi, difluorclorometoxi, trifluoretoxi,

difluórometiltio, difluorclorometiltio o trifluórometiltio, con la condición de que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 no signifiquen, simultáneamente, hidrógeno, R^1 y R^2 o R^2 y R^3 significan, además, conjuntamente butadienileno substituido, en caso dado, por flúor, por cloro, por bromo o por metilo.

5 3.- Difluórometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, metiltio, trifluórometilo, difluórometoxi, trifluórometoxi, difluórometiltio o trifluórometiltio, con la condición de que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 no signifiquen, simultáneamente, hidrógeno.

10 4.- Difluórometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

R^1 , R^2 , R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y R^3 tiene los significados indicados en la reivindicación 1.

15 5.- Difluórometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

R^1 , R^2 , R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y R^3 significa flúor, cloro, bromo, metilo, trifluórometilo, trifluórometoxi o trifluórometiltio.

20 6.- Difluórometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

R^2 , R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y R^1 y R^3 tienen, independientemente entre sí, los significados indicados en la reivindicación 1.

25 7.- Difluórometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

104

R^1, R^3 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^4 significan, independientemente entre sí, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.

8.- Difluorometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1,

5 en la que

R^1, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^3 tienen, independientemente entre sí, los significados indicados en la reivindicación 1.

9.- Difluorometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1,

10 en la que

R^1, R^4 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.

10.- Difluorometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación

15 1, en la que

R^1, R^3 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^4 tienen, independientemente entre sí, los significados indicados en la reivindicación 1.

11.- Difluorometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación

20 1, en la que

R^1, R^3 y R^5 significan, respectivamente, hidrógeno y

R^2 y R^4 significan, independientemente entre sí, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.

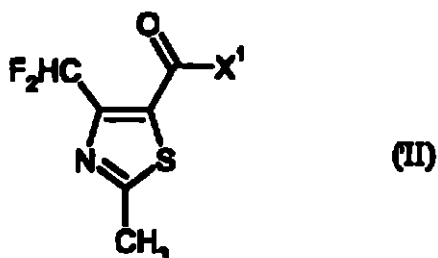
12.- Difluorometiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación

25 1, en la que R^5 significa hidrógeno.

13.- Procedimiento para la obtención de las difluorometiltiazolilcarboxanilidas de

la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque

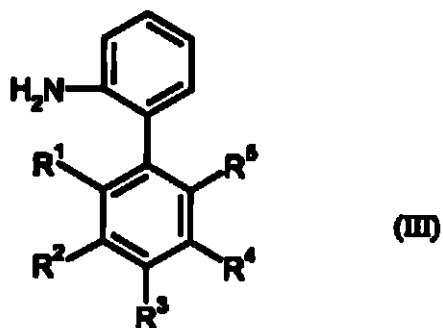
- a) se hacen reaccionar halogenuros del ácido difluormetiltiazolilcarboxílico de la fórmula (II)



5 en la que

X¹ significa halógeno,

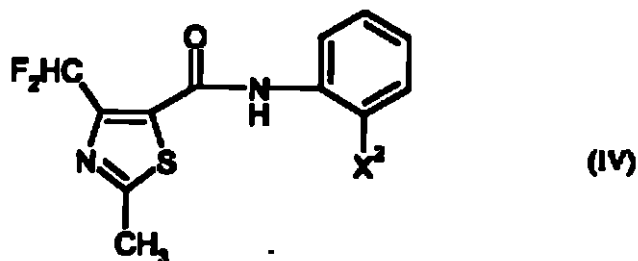
con derivados de anilina de la fórmula (III)



en la que

- 10 R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados indicados en la reivindicación 1, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

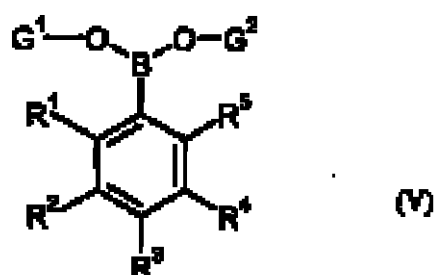
- b) se hacen reaccionar difluormetiltiazolilcarboxihalogenoanilidas de la fórmula (IV)



en la que

X^2 significa bromo o yodo,

con derivados del ácido borónico de la fórmula (V)



5

en la que

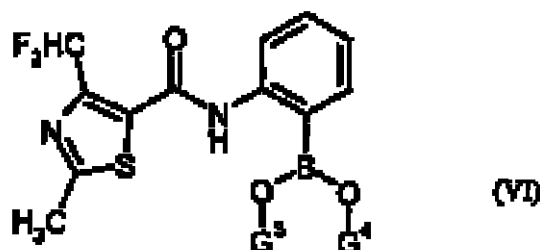
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

G^1 y G^2 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametilileno,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

10

c) se hacen reaccionar derivados de la difluormetiltiazolilcarboxanilida del ácido borónico de la fórmula (VI)

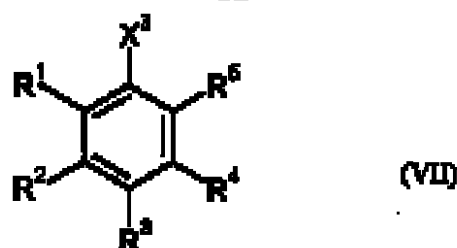


en la que

15

G^3 y G^4 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametilileno,

con derivados de halógenobenceno de la fórmula (VII)



en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

X^3 significa bromo, yodo o trifluorometilsulfoniloxi,

5 en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

14.- Agente para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado por un contenido en al menos una tiazolilcarboxanilida de la fórmula (I), según la reivindicación 1, junto con extendedores y/o productos tensioactivos.

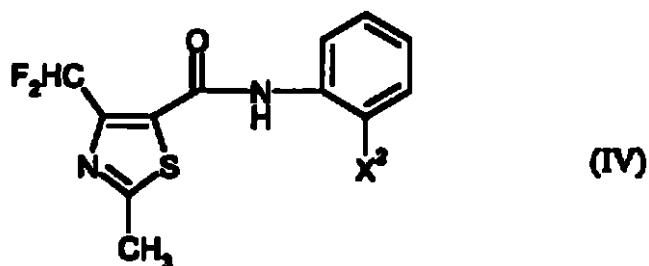
10 15.- Empleo de tiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, para la lucha contra los microorganismos indeseados.

16.- Procedimiento para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado porque se aplican tiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1 sobre los microorganismos y/o sobre su medio ambiente.

15 17.- Procedimiento para la obtención de agentes para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado porque se mezclan tiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, con extendedores y/o con productos tensioactivos.

18.- Difluorometiltiazolilcarboxihalogenoanilidas de la fórmula (IV)

- 54 -

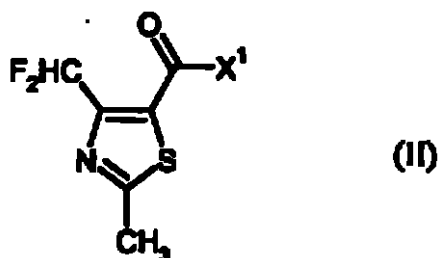


en la que

X^2 significa bromo o yodo.

19.- Procedimiento para la obtención de difluormetiltiazolilcarboxihalogeno-
5 anilidas de la fórmula (IV), según la reivindicación 18, caracterizado porque

d) se hacen reaccionar halogenuros de difluormetiltiazolilcarbonilo de la fórmula
(II)

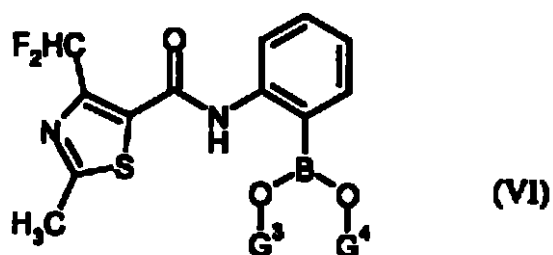


en la que

10 X^1 significa halógeno,

con 2-bromoanilina o 2-yodoanilina.

20.- Derivados de la difluormetiltiazolilcarboxanilida del ácido borónico de la
fórmula (VI)

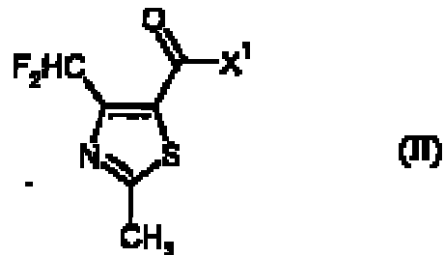


15 en la que

G^3 y G^4 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametiletileno.

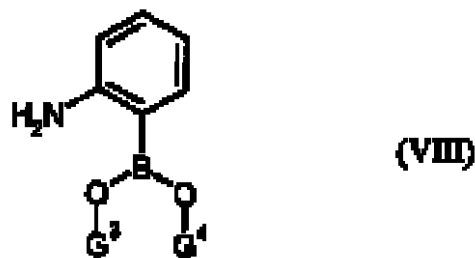
21.- Procedimiento para la obtención de derivados de la difluormetil-tiazolilcarboxanilida del ácido borónico de la fórmula (VI), según la reivindicación 20, caracterizado porque

e) se hacen reaccionar halogenuros de difluormetil-tiazolilcarbónico de la fórmula (II)



en la que

X^1 significa halógeno,
con derivados del ácido anilino-borónico de la fórmula (VIII)

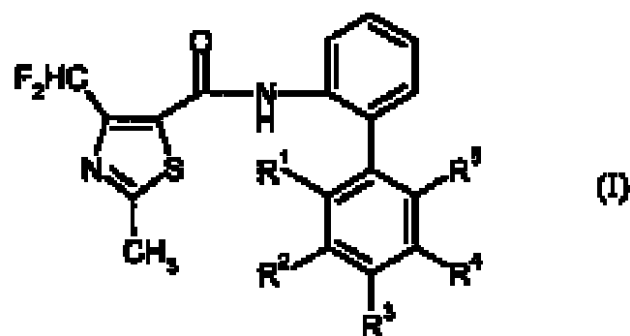


en la que

G^3 y G^4 tienen los significados indicados en la reivindicación 20,
en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

RESUMEN

Nuevas difluormetiltiazolilcarboxanilidas de la fórmula (I)



en la que

- 5 R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados indicados en la descripción, varios procedimientos para la obtención de éstos productos y su empleo para la lucha contra los microorganismos indeseados, así como nuevos productos intermedios y su obtención.

Expediente No		No de Unidades	No de Folio
Item			
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	2	1
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		
Observaciones: <i>Arte Final</i>			

112

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicalacion • 84086482 80000000 Folios 112
Fecha (AMD) • 2004-09-02 16:56:22
Tramite • 811 PCT-PATENT 379 FASE HACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 68,241
FECHA : AGOSTO 30 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	23490086	30/08/2004	30.125,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	422,000.00
	TOTAL :	\$ 422,000.00

SON: CUATROCIENTOS VEINTIDOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 13549-841-018-6

52
H3

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 04086402 00000000

Folios: 112

Fecha (AMD): 2004-09-02 16:56:22

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE MACI 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION ✓	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
- Descripción de la invención.	()	()
- Dibujos de ser estos pertinentes. X	()	()
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()
DISEÑO INDUSTRIAL ()		
- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	()	()
- Representación gráfica o fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()
ESQUEMA DE TRAZADO ()		
- Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud.	()	()
- Representación gráfica del esquema de trazado	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()

Firma Responsable:

Claudia Nervo

Fecha:

2020

Bogotá D C

Doctor(a)
EMILIO FERRERO
Apoderado
BAYER CROPSCIENCE

Oficio N° **62672**

ASUNTO:

Radicación N°	04-86402
Solicitud internacional	PCT/EP03/00589
Fecha inicio fase nacional	2004-09-04
Trámite	011
Evento	379
Actuación	430
Folios	001

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:

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

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

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha,
202063 202063

1000/1001