



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

05-49751

54. TITULO

THAZOL-(BT)CICLOALQUIL-CARBOXANTLIDAS

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

Monheim, República Federal de Alemania.

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén.

22. BOGOTA, D.C.,


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

Radicación: 05349751 00000000

Folios: 119

Fecha (IMP): 2003-10-23 17:25:20

 Remite: 011 MCI-PN/ENI 4/3 PASE MML 411 PASECHIM
 Dependencia: 2020 DIVISION DE MARCA Y DISEÑO

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**
SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.
☐ Capítulo I.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☒ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

 Nombre: **BAYER CROPSCIENCE AG**
 sociedad constituida y existente bajo las
 leyes de la República Federal de Alemania

 Dirección: Alfred-Nobel-Str. 50,
 40789 Monheim,
 República Federal de Alemania
 Domicilio: Monheim, República Federal de
 Alemania

IDENTIFICACIÓN

 C.C. ☐ NIT ☐

 C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

 Nombre: **EMILIO FERRERO**
 Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
 Teléfono: 347 36 11
 Fax: 211 88 50
 E-mail: clientes@camyp.com
 Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

 C.C. ☒ NIT ☐

 C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

 Número 438.019 T.P. 31.929

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

 1. **Ralf DUNKEL**
 Krischerstr. 22,
 40789 Monheim,
 República Federal de Alemania

 3. **Hans-Ludwig ELBE**
 Dasnöckel 59,
 42329 Wuppertal,
 República Federal de Alemania

 5. **Ulrike WACHENDORFF-NEUMANN**
 Oberer Markenweg 85,
 56566 Neuwied,
 República Federal de Alemania

 7. **Peter DAHMEN**
 Altebrücker Str. 61,
 41470 Neuss,
 República Federal de Alemania

 2. **Helko RIECK**
 9, rue Claude Monet,
 F-69110 Sts. Foy-lès-Lyon
 Francia

 4. **Jörg Nico GREUL**
 Am Sandberg 30ª,
 42799 Leichlingen,
 República Federal de Alemania

 6. **Karl-Heinz KUCK**
 Pastor-Löh-Str. 30 a,
 40764 Langenfeld,
 República Federal de Alemania

5

PCT (86)

 Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/011392

 Fecha: 15 de Octubre de 2003

 Publicación Internacional No. WO 2004/039789 A1

 Fecha: 13 de Mayo de 2004

6

Título (54)
TIAZOL-(BI)CICLOALQUIL-CARBOXANILIDAS

7

Clasificación Internacional (51) C07D 277/56, A01N 43/78

8	Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	SI ☒ NO ☐	<u>DE</u>	<u>28 de Octubre de 2002</u>	<u>102 50 110.6</u>

9 Comprobante de pago No.: 05 – 35,926 Fecha: 16 de Mayo de 2005

10

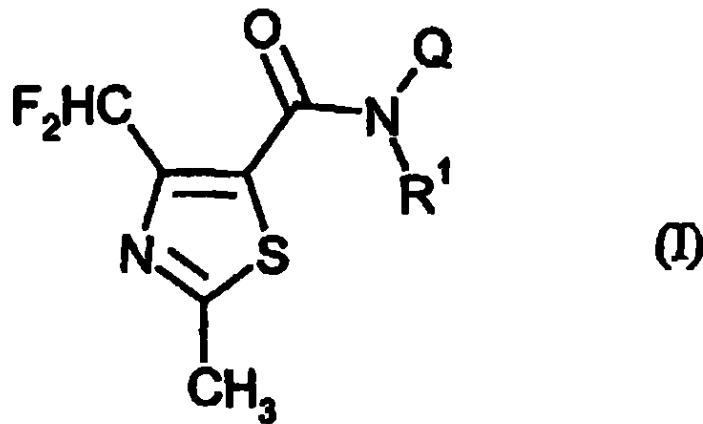
Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 443.000.00.
- ☐ 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 4.17 (II) 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 de acuerdo con la Regla 4.17 (III) del PCT con relación a la autorización de la compañía solicitante a reivindicar prioridad de la solicitud No. 10250110.6 por un convenio entre las compañías Bator Aktiengesellschaft y Bayer CropScience AG.
- ☒ 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 acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 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.** Traducción a español de las declaraciones contenidas en la Solicitud PCT con relación a la autorización de la compañía a solicitar y obtener una patente.

Ver hoja anexa con listado de documentos aportados.

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

Emilio Ferrero
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-¹³⁵⁴⁹ATTORNEY ¹⁰⁹⁶⁶

Yo (nosotros), abajo firmado (s)/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 nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (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 Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare 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 suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola 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 (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan 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, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 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 is to replace the first or second alternates in their turn. In such cases, the principal representative and alternates in their turn, or both, shall declare their intention not to act as representatives 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 alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates 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,

Administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los
Así como de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes
Así como: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y
Así como: diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas,
defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales,
enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de
origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio,
cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos;
b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor,
oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial,
nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la
protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles,
penales, administrativos o contenciosos administrativos relacionados con
estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos
promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan
sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del
proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de
agentes oficiosos.

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 Court
cancellation, 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, desist, 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

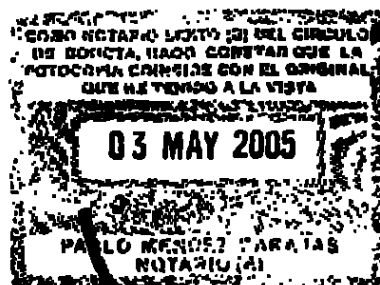
Firma

Signature

Bayar CropScience AG

Ma. BL

P. Bader



6

ATENTACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

Ascrito Notario Certifica: Que la firma que antecede de

Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo

de Secretarias
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 Jesse

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.

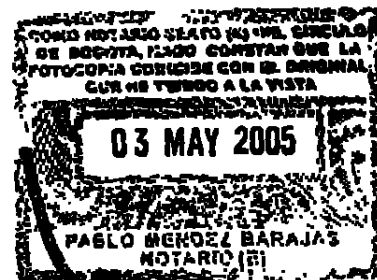
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



HRNr. 242/2003

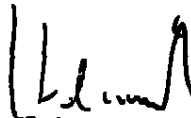
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

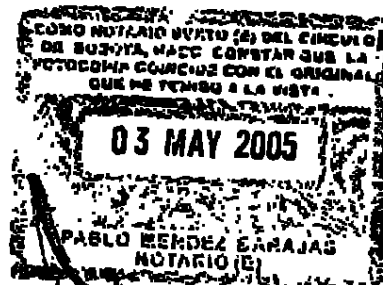
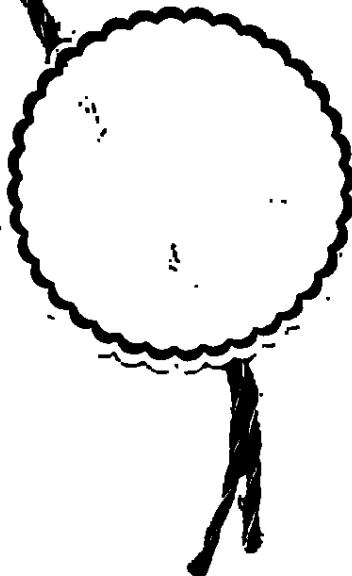
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- 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 2. Februar 2003


Notar



Kaizer Crayon AG
COLO 12.549-541-002.0

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 (der) Notars Dirk Heiderhoff
in Leverkusen

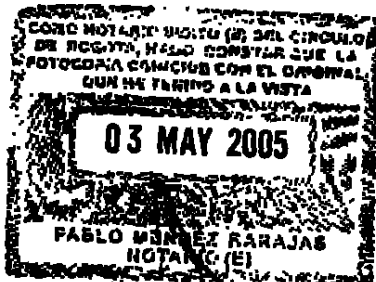
Bestätigt 17. FEB. 2003

5. in Köln 6. am _____

7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482103

9. Stempel/Siegel: 10. Unterschrift: L. v. Caliebe



RECHNUNG

10.-	10.-
10.-	10.-
Geb 9 100	EUR 13.-
	528
	28,08

Frank Heiderhoff, Notar

8

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. 832, domiciliados en la Carrera 4° No. 72-35.

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003

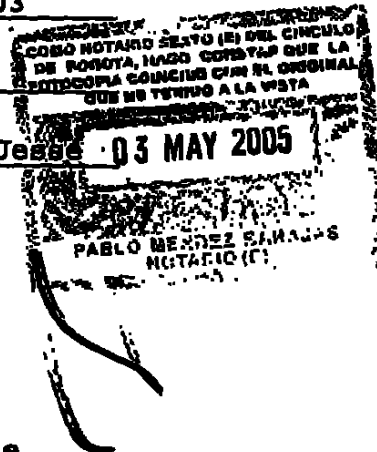
en Leverkusen

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 - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE FEBRERO 4 DE 1999.

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, 40789 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 14 de febrero de 2003 bajo el número 482/03.

RECEIVED
NOTARIAL
OFFICE
14 FEB 2003
11:00 AM
482/03

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

DVZ/ID-4268/WPCL002G/COLO 13549-841-002-0

Diego F. Jargabaz
DIEGO F. JARGABAZ
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA

COMO NOTARIO DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ, ME DO CONTESTO QUE LA FOTOCOPIA CORRESPONDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
03 MAY 2005
PABLO MENDEZ
NOTARIO

NO SE APLICA
 RESERVA DE TERCER
 2003 MAR 18 P 12:24
 JEFE DE LEGALIZACIÓN
 BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIRMA(S) PUESTA(S) POR [Firma]

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s) [Firma]

ES(SON) AUTENTICA(S):

SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

MINISTERIO DE
 RELACIONES EXTERIORES

208992
 D. J. J. J. J.
 P. J. J. J. J.
 P. J. J. J. J.
 P. J. J. J. J.

COMO NOTARIO SEXTO (S) DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA COINCIDE CON EL ORIGINAL DE TENIDO A LA VISTA

03 MAY 2005

PABLO MENDEZ GARCIA
 NOTARIO (S)



10

TRADUCCION OFICIAL No. 9450

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

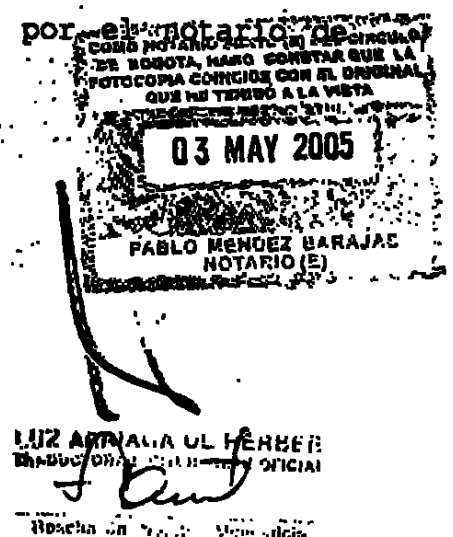
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, 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 antecedentes y certificación de existencia de la sociedad por el notario de Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



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-51368,
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)

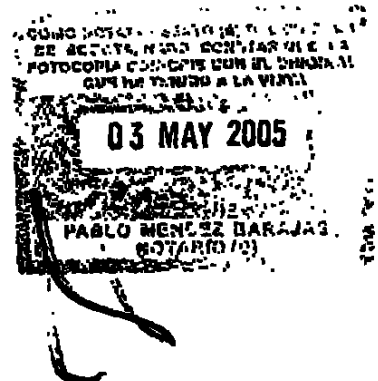
Fdo.: firma ilegible, Notario

Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45 EUROS 10,-



INIZ ABU... DE HERBER
INCU... OFICIAL
Reservado...

12

Derechos Art. 58	EUROS 10,-
Derechos Art. 150	Euros 13,-
IVA	<u>EUROS 5,28</u>
Total	EUROS 38,28

Fdo.: Heiderhoff, notario

APOSTILLA

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por Dirk Heiderhoff

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario Dirk Heiderhoff, notario en
Leverkusen

Certificado

5. en Colonia

6. El 17 de febrero 2003

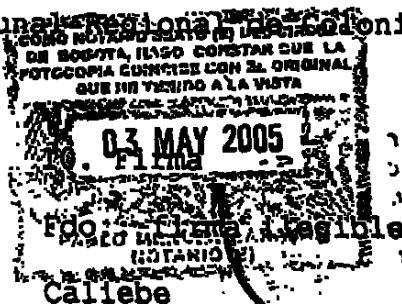
7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

9. Sello

El Presidente del

Tribunal Regional de Colonia



ES TRADUCCIÓN FIEL COMPLETA, de la cual se deja copia en los
archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 14 de marzo 2003.

LIZ AUBIALA DEL HERNÁNDEZ
Traducción Fiel y Certificada
Resolución No. 58. 2003

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993

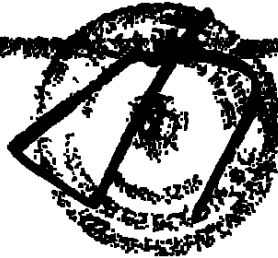
2003 MAR 18 P 12:24
JEFES DE SECCIONES
BOGOTÁ D.C.
CITA PARA AGENDE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

JEFES DE SECCIONES
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ISSA ANTERIORES FIR-
MADO PUESTO POR Alfonso J. de
Tejedor
IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)
ES(SON) AUTENTICAS
SANTA FE DE BOGOTA, 10 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO (S) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCORDA CON LA ORIGINAL
QUE HE VISTO A LA VISTA
03 MAY 2005
PAO D BARRON BARRAN
NOTARIO

DOCUMENTOS ANEXOS:

1. **Copia de la Publicación Internacional de la OMPI, WO 2004/039789 A1**
2. **Copia de la Memoria Descriptiva y del Pliego Revindicatorio tal y como se publicó (idioma alemán)**
3. **Copia de Formulario de Solicitud PCT (Contiene Declaraciones de acuerdo con la Regla 4.17 (ii) y (iii);**
4. **Copia de la Forma PCT/ISA/210; Informe de Búsqueda Internacional (inglés y alemán)**
5. **Copia de la Forma PCT/IPEA/409: Informe de Examen Preliminar Internacional (traducción al inglés)**

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
13. Mai 2004 (13.05.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 2004/039789 A1

not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 271/56,
A01N 43/78

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/011392

(22) Internationales Anmeldedatum:
15. Oktober 2003 (15.10.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 50 110.6 28. Oktober 2002 (28.10.2002) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DUNKEL, Ralf
[DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE). RIECK,
Helko [DE/FR]; 9, rue Claude Monet, F-69110 Ste.
Foy-lès-Lyon (FR). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE];
Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). GREUL, Jörg,
Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen
(DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE];
Oberer Markonweg 85, 56566 Neuwied (DE). KUCK,
Karl-Helmut [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30 a, 40764 Lan-
genfeld (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrücker
Str. 61, 41470 Neuss (DE).

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

(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, EG, ES, FI, GB, GD,
GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN,
MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU,
SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, 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, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer II) für die fol-
genden 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, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD,
SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches
Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europä-
isches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES,
FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI,
SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

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

Veröffentlicht:

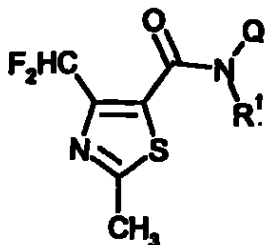
— mit internationalem Recherchenbericht

(Fortsetzung auf der nächsten Seite)

(54) Title: THIAZOL-(BI)CYCLOALKYL-CARBOXANILIDES

LeA 36 186

(54) Bezeichnung: THIAZOL-(BI)CYCLOALKYL-CARBOXANILIDE



(I)

(57) Abstract: The invention concerns novel thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilides of formula (I), wherein Q and R¹ are such as defined in the description. The invention also concerns a method for producing said substances and their use for fighting against undesirable micro-organisms.

(57) Zusammenfassung: Neue Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher Q und R¹ die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, ein Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.

WO 2004/039789 A1

WO 2004/039789 A1



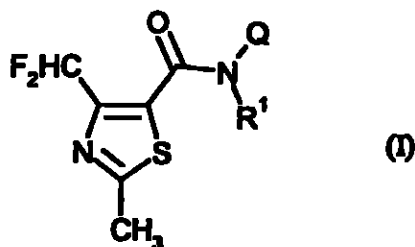
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide

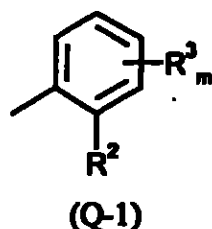
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 02/059086, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, EP-A 0 315 502 und EP-A 0 276 177). So sind z.B. bereits die folgenden Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide bekannt geworden: 2-Amino-*N*-(2-cyclohexylphenyl)-4-(trifluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid und 2-Amino-*N*-(2-cyclopentylphenyl)-4-(trifluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 589 301, *N*-(2-Cyclohexylphenyl)-2-methyl-4-(trifluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid und *N*-(2-Cyclopentylphenyl)-2-methyl-4-(trifluormethyl)-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 545 099, 2-Methyl-4-(trifluormethyl)-*N*-(1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1*H*-inden-4-yl)-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 276 177 und 2-Methyl-4-(trifluormethyl)-*N*-(1,1,3-trimethyl-1,3-dihydro-2-benzofuran-4-yl)-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 315 502. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

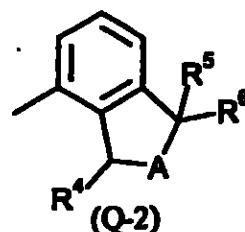
Es wurden nun neue Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I)



gefunden, in welcher
Q für eine Gruppe



oder

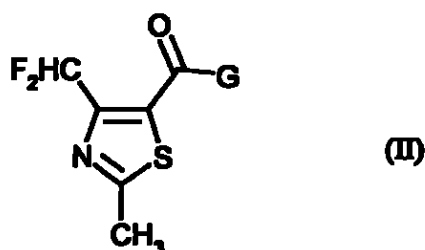


steht,

- R¹** für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹ steht,
- R²** für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkenyl, C₆-C₁₂-Bicycloalkyl oder C₆-C₁₂-Bicycloalkenyl steht,
- R³** für Fluor, Chlor, Brom oder Methyl steht,
- m** für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,
- A** für O (Sauerstoff) oder CR¹² steht,
- R⁴, R⁵, R⁶ und R¹²** unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl stehen,
- R⁷** für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl steht,
- R⁸ und R⁹** unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R⁸ und R⁹** außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₈-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹³ enthalten kann,
- R¹⁰ und R¹¹** unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R¹⁰ und R¹¹** außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₈-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹³ enthalten kann,
- R¹³** für Wasserstoff oder C₁-C₈-Alkyl steht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) erhält, indem man

A) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



in welcher

G für Halogen, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

in einem ersten Schritt mit Anilin-Derivaten der Formel (III)

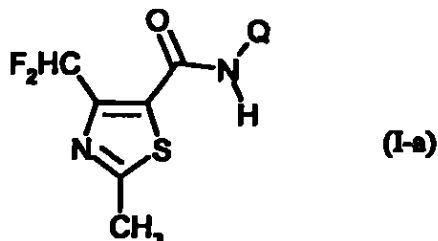


in welcher

Q die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Säurebindemittels und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt

und die so erhaltenen Produkte der Formel (I-a)



in welcher

Q die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in einem zweiten Schritt mit einem Halogenid der Formel (IV)



in welcher

R¹⁻¹ für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylsul-

fanyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹ steht, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5 X für Chlor, Brom oder Iod steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

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

10

Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) eine wesentlich bessere fungizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Wirkstoffe gleicher Wirkungsrichtung.

15

Die erfindungsgemäßen Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend erwähnten Formeln aufgeführten Reste werden im Folgenden erläutert.

20

R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff; C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₇-Alkoxy-C₁-C₇-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹.

25

R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylsulfonyl, Difluorchlormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹.

30

- R¹** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl oder -COR⁷.
- R²** steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes C₃-C₁₂-Cycloalkyl substituiertes C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₇-C₁₂-Cycloalkenyl, C₆-C₁₂-Bicycloalkyl oder C₆-C₁₂-Bicycloalkenyl.
- R²** steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, n-, iso-, sec- oder tert-Butoxy, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Difluorchlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Difluorchlormethoxy substituiertes C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, C₆-C₁₀-Bicycloalkyl oder C₆-C₁₀-Bicycloalkenyl.
- R²** steht ganz besonders bevorzugt für jeweils einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, iso-Propoxy, tert-Butoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Cyclooctenyl, Bicyclo[4.1.0]heptyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl.
- R³** steht bevorzugt für Fluor, Brom oder Methyl.
- R³** steht besonders bevorzugt für Fluor oder Methyl.
- m** steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.
- m** steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.
- A** steht bevorzugt für O (Sauerstoff).
- A** steht bevorzugt für CR¹².
- R⁴** steht bevorzugt für Methyl oder Ethyl.
- R⁴** steht besonders bevorzugt für Methyl.
- R⁵ und R⁶** stehen bevorzugt jeweils für Methyl.

- 5 R^7 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl.
- R^7 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl.
- 10 R^7 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl.
- R^8 und R^9 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 15 R^8 und R^9 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{13} enthalten kann.
- 20 R^8 und R^9 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.
- 25 R^8 und R^9 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^{13} substituiert sein kann.
- 30 R^{10} und R^{11} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 35 R^{10} und R^{11} bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8

Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹³ enthalten kann.

R¹⁰ und R¹¹ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R¹⁰ und R¹¹ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R¹³ substituiert sein kann.

R¹² steht bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.

R¹² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff.

R¹³ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

R¹³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher R¹ für Wasserstoff steht.

Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher R¹ für Methyl steht.

Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher R¹ für -CHO steht.

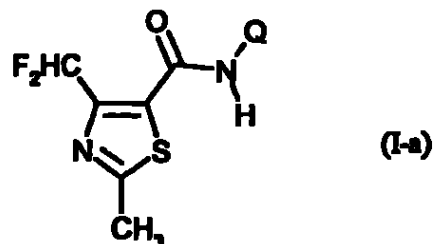
Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher R¹ für Methylcarbonyl (Acetyl) steht.

Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher Q für Q-1 und R² für Bicyclo[2.2.1]heptyl (Norbornanyl) steht.

Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher Q für Q-1 und m für 0 steht.

Weiterhin bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I), in welcher Q für Q-1, m für 1 und R³ für Fluor oder Methyl steht.

Außerdem bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-a)

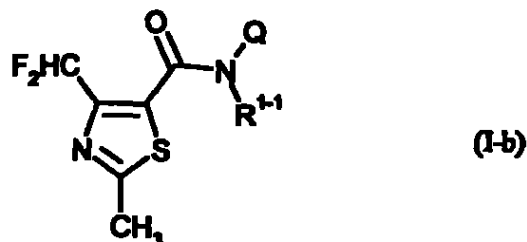


in welcher

Q die oben angegebenen Bedeutungen hat.

5

Außerdem bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-b)



in welcher

Q die oben angegebenen Bedeutungen hat,

10 R^{1-1} für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $-COR^7$, $-CONR^8R^9$ oder $-CH_2NR^{10}R^{11}$ steht,

15 R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} und R^{11} die oben angegebenen Bedeutungen haben.

20 R^{1-1} steht bevorzugt für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $-COR^7$, $-CONR^8R^9$ oder $-CH_2NR^{10}R^{11}$.

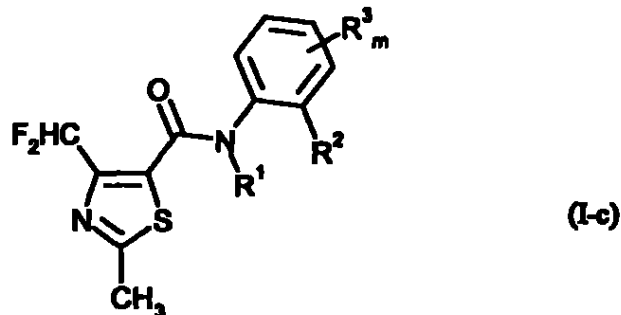
25 R^{1-1} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl,

Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylsulfanyl, Difluorchlor-methylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethyl-sulfonyl, Trifluormethoxymethyl; $-\text{COR}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ oder $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$.

R^{1-1} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder $-\text{COR}^7$.

5

Außerdem bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-c)

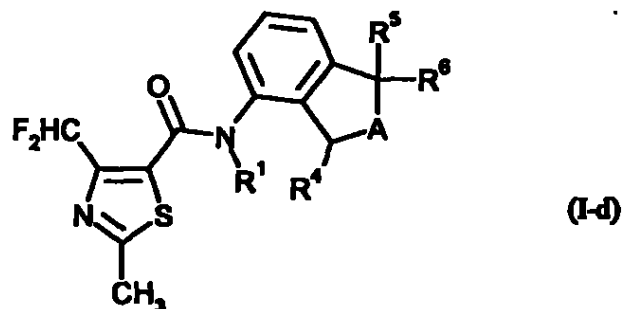


in welcher

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

10

Außerdem bevorzugt sind Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-d)



in welcher

A , R^4 , R^5 und R^6 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

15

Auf die Verbindungen der Formeln (I-a), (I-b), (I-c) und (I-d) sind die bevorzugten, besonders bevorzugten und ganz besonders bevorzugten Definitionen der jeweiligen Reste R^1 bis R^{13} , Q, m und A entsprechend anzuwenden.

20

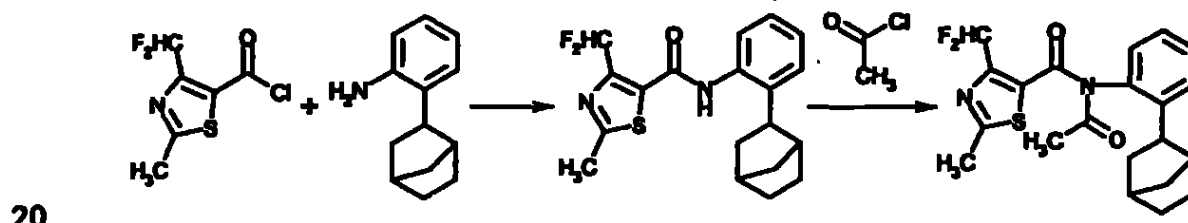
Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

5 Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach Halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

10 Die oben aufgeführten allgemein oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend. Außerdem können auch einzelne Definitionen entfallen.

15 Verwendet man 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-5-carbonylchlorid und 2-Bicyclo[2.2.1]hept-2-ylanilin als Ausgangsstoffe im ersten Schritt und zusätzlich Acetylchlorid als Ausgangsstoff im zweiten Schritt, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens A) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Erläuterung der Verfahren und Zwischenprodukte

25 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens A) im ersten Schritt als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel steht G bevorzugt für Chlor, Brom, Hydroxy, Methoxy oder Ethoxy, besonders bevorzugt für Chlor, Hydroxy oder Methoxy, ganz besonders bevorzugt für Chlor.

30 Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. EP-A 0 545 099 und EP-A 0 589 313).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens A) als Reaktionskomponenten im ersten Schritt benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel hat Q vorzugsweise eine der Bedeutungen Q-1 und Q-2.

- 5 Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind bekannt und/oder lassen sich teilweise nach bekannten Methoden herstellen (vgl. EP-A 0 545 099 und EP-A 0 589 301 im Falle von Q-1, EP-A 0 654 464, EP-A 0 315 502 und EP-A 0 280 275 im Falle von Q-2).

- 10 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens A) als Reaktionskomponenten im zweiten Schritt eingesetzten Verbindungen der Formel (I-a) sind eine Untergruppe der erfindungsgemäßen Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) und somit ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung.

- 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens A) als Reaktionskomponenten im zweiten Schritt benötigten Halogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel hat Q vorzugsweise eine der Bedeutungen Q-1 und Q-2. R^{1-1} steht bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I-b) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden. X steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

20

Halogenide der Formel (III) sind bekannte Syntheschemikalien.

- 25 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des ersten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Es ist jedoch auch möglich, ohne zusätzliches Säurebindemittel zu arbeiten, oder die Aminkomponente in einem Überschuss einzusetzen, so dass sie gleichzeitig als Säurebindemittel fungiert.

35

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des ersten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien infrage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls Halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; 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; 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 oder Sulfone, wie Sulfolan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 140°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Bei der Durchführung des ersten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des ersten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) setzt man auf 1 Mol an Carbonsäure-Derivat der Formel (II) im allgemeinen 1 Mol oder auch einen Überschuss an Anilin-Derivat der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch mit Wasser versetzt, die organische Phase abtrennt und nach dem Trocknen unter vermindertem Druck einengt. Der verbleibende Rückstand kann gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit werden.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des zweiten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispiels-

weise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-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.

Der zweite Schritt des erfindungsgemäßen Verfahrens A) wird 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 des zweiten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) 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.

Bei der Durchführung des zweiten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens A) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Zur Durchführung des zweiten Schrittes des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Thiazolylbiphenylamids der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (III) ein.

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.

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

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

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*;
15 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
20 *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*;
25 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
30 Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
35 Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;

- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
5 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
10 Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

15

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

20

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.

25

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.

30

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

35

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.

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 Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen 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 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 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.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. 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 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
5 Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und
10 Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,
15 Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,
Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,
Coniophora, wie *Coniophora puctana*,
Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,
Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,
20 Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,
Escherichia, wie *Escherichia coli*,
25 Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,
Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen,
30 Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der
35 Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüs-

sigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln 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 Lösungs-
mittel kommen im wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-
naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie
Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie
Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, 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, Stick-
stoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteins-
mehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Dia-
tomeerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid
und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und
fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie syn-
thetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus orga-
nischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als
Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und an-
ionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether,
z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhy-
drolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methyl-
cellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und
synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummi-
arabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline
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 %.

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 Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat;

Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflurnet; Ampopylfos; Ampopylfos-potassium; Andoprime; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin;

Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin;

Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram;

Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Diflumentorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon;

Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole;

Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfiram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al;

Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Fumecycloz;

- 20 -

- Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol;
 Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb;
 Ipeconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione;
 Kasugamycin; Kresoxim-methyl;
 5 Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Met-
 conazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax;
 Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin;
 Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol;
 Ofurace; Oryastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthion;
 10 Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxy-
 strobil; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone;
 Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole;
 Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenoxy; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine;
 Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur;
 15 Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thi-
 cyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Toly-
 flusnid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole;
 Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole;
 Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide;
 20 (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-
 2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-
 Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid;
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid; 3,4,5-
 Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-
 25 yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-
 carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropanocarboxamid;
 N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat;
 sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfer-
 naphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-
 30 copper.

Bakterizide:

- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Oc-
 thilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam,
 35 Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

- Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz,
- 5 Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin,
- Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Ben-
- 10 furacarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben,
- 15 Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clo-
- 20 fentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine,
- DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Disflubenzuron,
- 25 Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439,
- Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,
- 30 Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocylthrin, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Flu-
- 35 valinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Flu-

- proxyfen), Furathiocarb,
 Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, Granuloseviren,
 Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox,
 Hydramethylnone, Hydroprene,
 5 IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Iso-
 fenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure,
 Kadethrin, Kempolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron,
 Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamido-
 phos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb,
 10 Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone,
 Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxi-
 dectin, MTI-800,
 Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram,
 Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron,
 15 OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxy-
 demeton-methyl,
 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-),
 Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phos-
 met, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-
 20 methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Pro-
 petamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyres-
 methrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyri-
 proxyfen,
 Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525,
 25 S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiro-
 mesifen, Sulfuramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,
 Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin,
 Temephos, Temiviphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin,
 Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thia-
 30 pronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thio-
 sultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Tri-
 arathene, Triazamate, Triazophos, Triazaron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron,
 Trimethacarb,
 Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii,
 35 WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xyllycarb,

ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901,
die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbammat (Tsumacide Z),
die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-
carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-
5 Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923),

sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren
enthalten.

10 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 antimykotisches
15 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 Aufzählung dieser Pilze
20 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 bereiteten
Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten,
25 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.

30 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
35 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.

5 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
10 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.

15 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.

20 Je 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 verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres
25 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
30 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 besondere
35 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 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, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken 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“).

5

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.

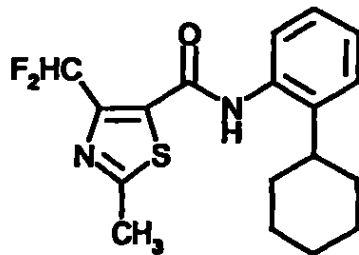
10

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

15

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1



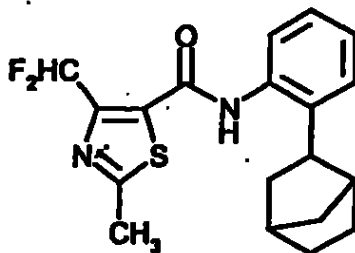
5

Zu einer Suspension von Kaliumcarbonat (138 mg) in Acetonitril (30 ml) werden 2-Cyclohexylanilin (175 mg, 1 mmol) und 4-(Difluoromethyl)-2-methyl-1,3-thiazole-5-carbonylchlorid (212 mg, 1 mmol) getropft. Das Reaktionsgemisch wird für 10 Stunden gerührt.

10 Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch mit Wasser (30 ml) versetzt und anschließend mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird mit Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und eingengt. Der Rückstand wird an Kieselgel (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester 100:0 → 20:80) gereinigt.

15 Man erhält 210 mg (57 %) an N-(2-Cyclohexylphenyl)-4-(difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-5-carboxamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.50

Beispiel 2



20

Zu einer Suspension von Kaliumcarbonat (415 mg) in Acetonitril (30 ml) werden 2-Bicyclo[2.2.1]hept-2-ylanilin (562 mg, 3 mmol) und 4-(Difluoromethyl)-2-methyl-1,3-thiazole-5-carbonylchlorid (635 mg, 3.6 mmol) getropft. Das Reaktionsgemisch wird für 10 Stunden gerührt.

Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch mit Wasser (30 ml) versetzt und anschließend mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird mit Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und eingengt. Der Rückstand wird an Kieselgel (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester 100:0 → 20:80) gereinigt.

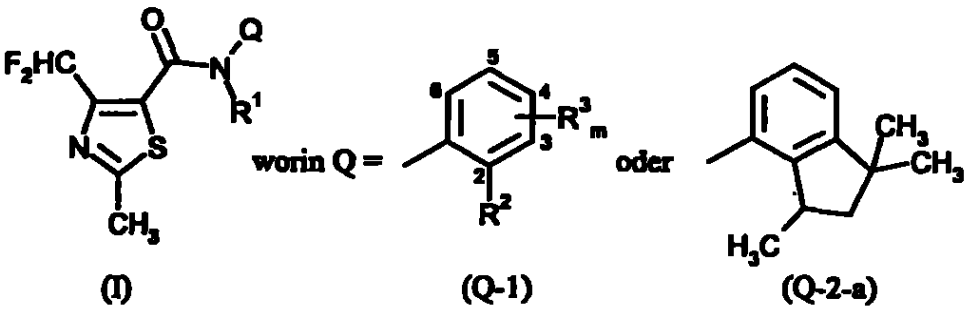
5

Man erhielt 150 mg (13 %) an N-(2-Bicyclo[2.2.1]hept-2-ylphenyl)-4-(difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-5-carboxamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.63

10

Analog den Beispielen 1 und 2 sowie den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen werden auch die in der folgenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen hergestellt.

Tabelle 1



Bsp.	Q	R ¹	R ²	R ³ _m	logP (pH2.3)
3	Q-1	H	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	4-CH ₃	3.92
4	Q-1	H	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	5-CH ₃	4.00
5	Q-1	H	Cycloheptyl	4-F	3.84
6	Q-1	H	Cyclopentyl	4-F	3.24
7	Q-2-a	H	–	–	3.62
8	Q-1	H	Cyclooctyl	–	4.06
9	Q-1	H	Cyclooctyl	4-CH ₃	4.43
10	Q-1	H	Cyclopentyl	4,5-(CH ₃) ₂	3.78
11	Q-1	H	Cyclooctyl	4-F	4.10
12	Q-1	H	Cyclooctyl	5-CH ₃	4.44
13	Q-1	H	Cyclooctyl	5-F	4.10
14	Q-1	H	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	4-Br	4.27
15	Q-1	H	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	4,5-(CH ₃) ₂	4.22
16	Q-1	H	Cyclopentyl	–	3.19
17	Q-1	H	4-Methylcyclohexyl	–	3.82

Bsp.	Q	R ¹	R ²	R ³ _m	logP (pH2.3)
18	Q-1	H	(3 <i>R</i>)-3-Methylcyclohexyl	—	3.88
19	Q-1	CH ₃	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	—	3.96
20	Q-1	CH ₃	Cyclohexyl	—	3.85
21	Q-1	COCH ₃	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	—	3.95
22	Q-1	COCH ₃	Cyclohexyl	—	3.86
23	Q-1	H	2-Cyclohepten-1-yl	4-F	3.68
24	Q-1	H	Cycloheptyl	—	3.81

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

Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

Die Eichung erfolgte 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).

Die lambda-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 Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton

 24,5 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil 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 bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inokuliert. Die Pflanzen werden dann bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % im Gewächshaus aufgestellt.

20

7 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.

25

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle A
Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

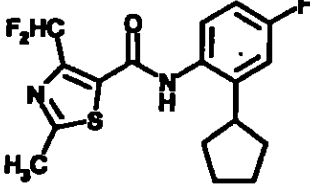
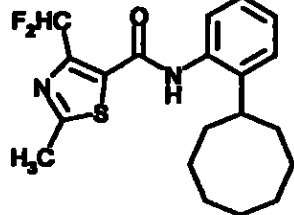
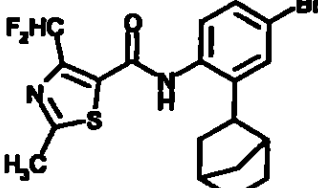
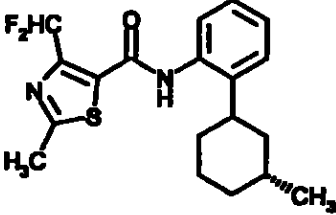
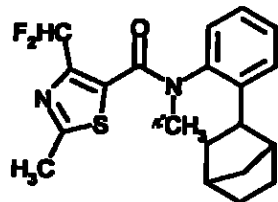
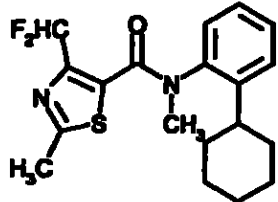
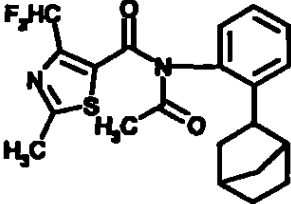
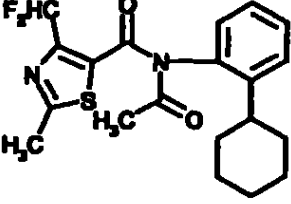
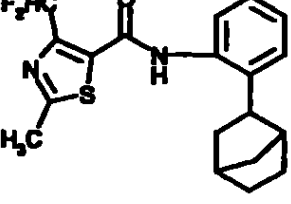
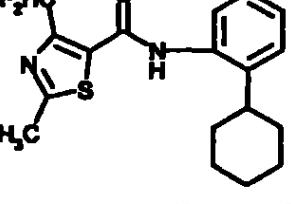
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
6 	100	88
8 	100	93
14 	100	100
18 	100	100
19 	100	98
20 	100	100

Tabelle A
Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
21 	100	98
22 	100	96
2 	100	100
1 	100	89

Beispiel B**Venturia - Test (Apfel) / protektiv**

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

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 Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

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.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

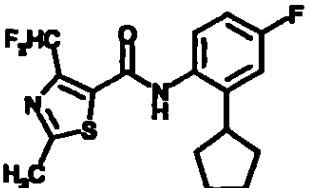
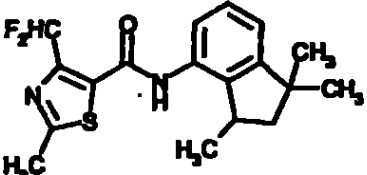
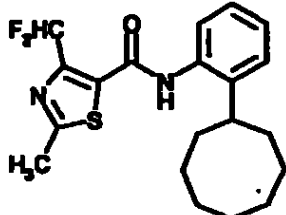
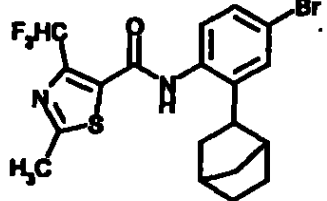
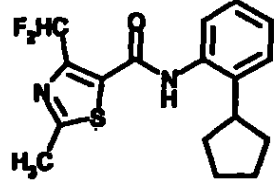
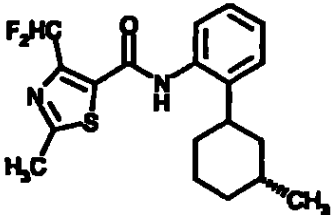
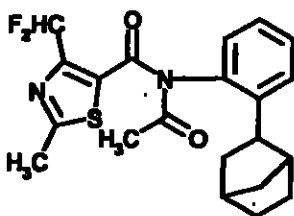
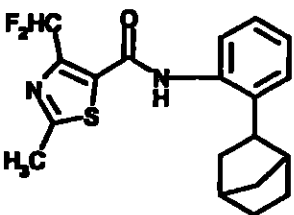
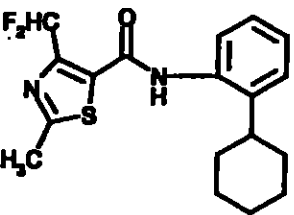
Wirkstoff		Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
6		100	99
7		100	100
8		100	100
14		100	100
16		100	99
18		100	100

Tabelle B
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
21 	100	96
2 	100	100
1 	100	100

Beispiel C**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

- 5 **Lösungsmittel:** 25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
 Emulgator: 0,6 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

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.

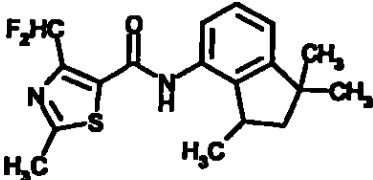
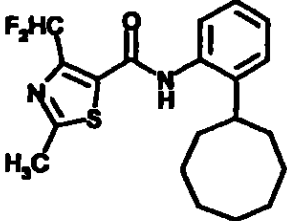
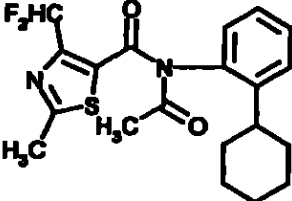
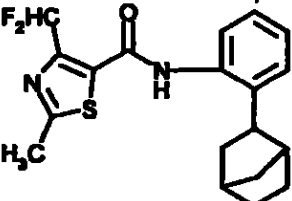
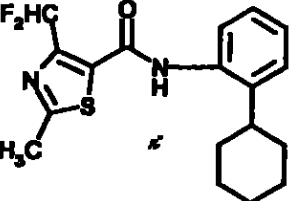
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von *Puccinia recondita* besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20 Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.

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.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C
Puccinia - Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
7 	500	100
8 	500	100
22 	500	93
2 	500	100
1 	500	100

Beispiel D**Alternaria-Test (Tomate) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

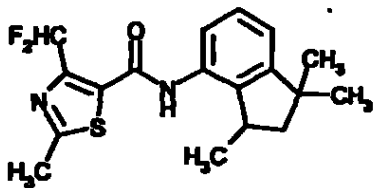
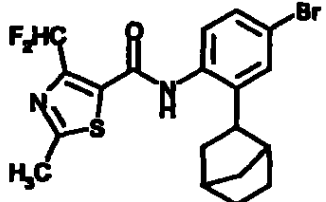
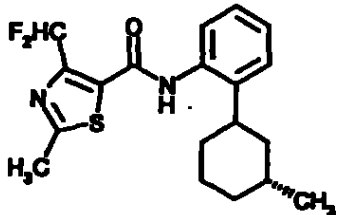
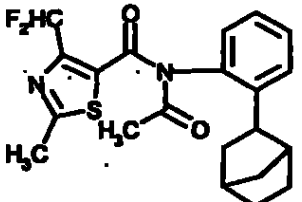
10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

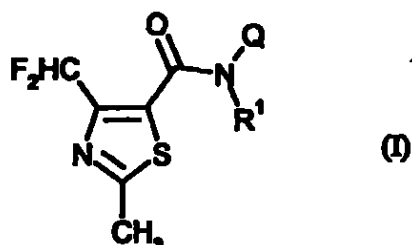
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Tomatenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Alternaria solani* inokuliert. Die Pflanzen stehen dann 24 Stunden bei 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 20°C.

20 7 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.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle D
Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

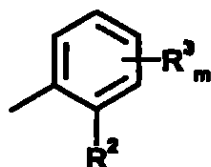
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
7 	750	100
14 	750	95
18 	750	100
21 	750	100

Patentansprüche**1. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I)**

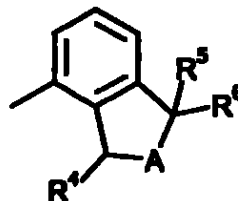
5

in welcher

Q für eine Gruppe



oder



steht,

10

R¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹ steht,

15

R² für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkenyl, C₆-C₁₂-Bicycloalkyl oder C₆-C₁₂-Bicycloalkenyl steht,

20

R³ für Fluor, Chlor, Brom oder Methyl steht,

m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

A für O (Sauerstoff) oder CR¹² steht,

R⁴, R⁵, R⁶ und R¹² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl stehen,

25

R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-

alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₈-Halogen cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl steht,

R⁸ und R⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₈-Halogen cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

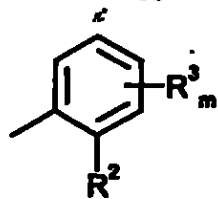
R⁸ und R⁹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹³ enthalten kann,

R¹⁰ und R¹¹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogen cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R¹⁰ und R¹¹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹³ enthalten kann,

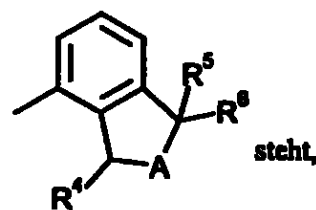
R¹³ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht.

2. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher Q für eine Gruppe



(Q-1)

oder



(Q-2)

steht,

R¹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,

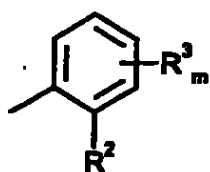
- Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹ steht,
- 5 R² für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes C₇-C₁₂-Cycloalkyl substituiertes C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkenyl, C₆-C₁₂-Bicycloalkyl oder C₆-C₁₂-Bicycloalkenyl steht,
- 10 R³ für Fluor, Brom oder Methyl steht,
 m für 0, 1, 2 oder 3 steht,
 A für O (Sauerstoff) oder CR¹² steht,
 R⁴, R⁵, R⁶ und R¹² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl stehen,
- 15 R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl steht,
- 20 R⁸ und R⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 25 R⁸ und R⁹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹³ enthalten kann,
- 30 R¹⁰ und R¹¹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 35 R¹⁰ und R¹¹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8

Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{12} enthalten kann,

R^{13} für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl steht.

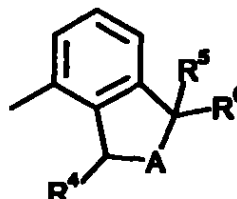
5

3. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
Q für eine Gruppe



(Q-1)

oder



(Q-2)

steht,

10

R^1 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylsulfanyl, Difluorchlormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; $-\text{COR}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ oder $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ steht,

15

R^2 für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, n-, iso-, sec- oder tert-Butoxy, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Difluorchlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Difluorchlormethoxy substituiertes C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkenyl, C_6 - C_{10} -Bicycloalkyl oder C_6 - C_{10} -Bicycloalkenyl steht,

25

R^3 für Fluor, Brom oder Methyl steht,

m für 0, 1, 2 oder 3 steht,

A für O (Sauerstoff) oder CR^{12} steht,

R^4 für Methyl oder Ethyl steht,

30

R^5 und R^6 jeweils für Methyl stehen,

R^7 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy oder 4-(Difluormethyl)-2-methyl-1,3-thiazol-2-yl steht,

R^8 und R^9 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl stehen,

R^8 und R^9 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin bilden, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^{13} substituiert sein kann,

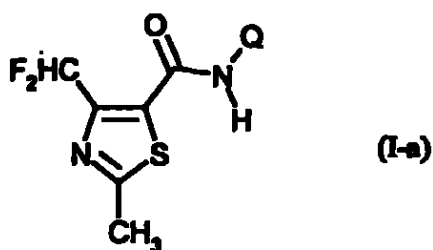
R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl stehen,

R^{10} und R^{11} außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin bilden, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^{13} substituiert sein kann,

R^{12} für Wasserstoff oder Methyl steht,

R^{13} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl steht.

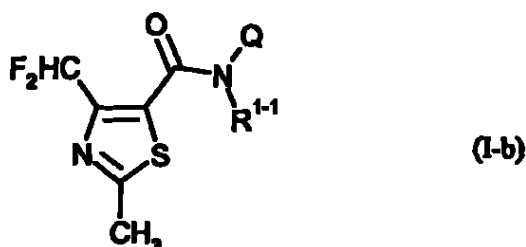
4. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-a)



in welcher

Q die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat.

5. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-b)

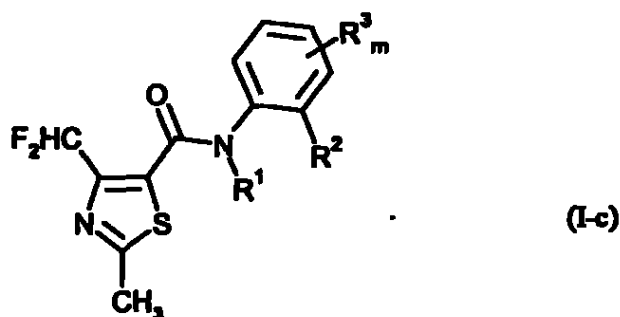


in welcher

Q die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat.

- 5 R¹⁻¹ für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹ steht,
- 10 R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

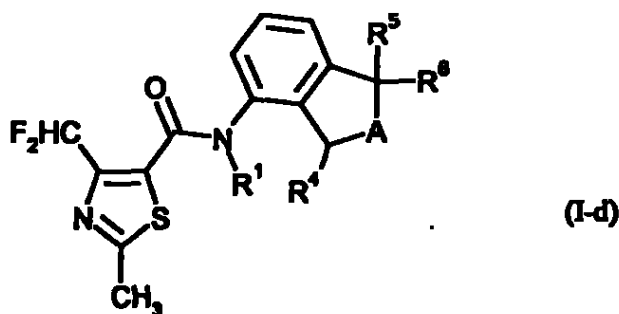
6. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-c)



in welcher

- 15 R¹, R² und R³ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

7. Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I-d)



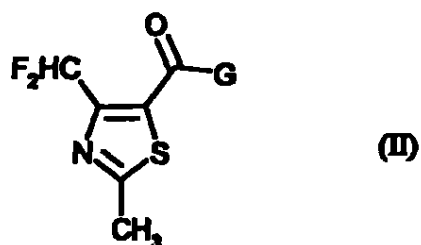
in welcher

A, R⁴, R⁵ und R⁶ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

8. Verfahren zum Herstellen von Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

5

- A) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



in welcher

G für Halogen, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

10

in einem ersten Schritt mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



in welcher

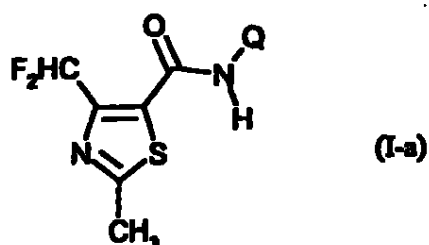
15

Q die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Säurebindemittels und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt

20

und die so erhaltenen Produkte der Formel (I-a)



in welcher

Q die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

25

gegebenenfalls in einem zweiten Schritt mit einem Halogenid der Formel (III)



in welcher

R^{1-1} für C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ oder -CH₂NR¹⁰R¹¹ steht,

R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

X für Chlor, Brom oder Iod steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

9. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

10. Verwendung von Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.

11. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

12. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Thiazol-(bi)cycloalkyl-carboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 IPC 7 C07D277/56 A01N43/78

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 A01N

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

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

EPO-Internal, 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.
Y	WO 02 08197 A (MAULER MACHNIK ASTRID; DUNKEL RALF (DE); KUGLER MARTIN (DE); RIECK) 31 January 2002 (2002-01-31) claims 1-4,15-18; examples 60,61	1-6,8-12
Y	EP 0 371 950 A (MONSANTO CO) 6 June 1990 (1990-06-06) claims 1,15,21; examples 27,28	1-6,9-12
Y	WO 02 059086 A (WALTER HARALD; TRAH STEPHAN (CH); SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)) 1 August 2002 (2002-08-01) cited in the application claims 1,10-13; table 4	1-12
	-/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

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

"E" earlier document but published on or after the international filing date

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

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

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

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

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

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, 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

17 February 2004

Date of mailing of the international search report

25/02/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5816 Patentplan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 051 epo nl,
 Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hass, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/11392

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 591 699 A (BASF AG) 13 April 1994 (1994-04-13) cited in the application claims 1,5-8; table 6	1-6,9-12
Y	EP 0 315 502 A (SUMITOMO CHEMICAL CO) 10 May 1989 (1989-05-10) cited in the application Tabelle 1, Seite 13, Verbindung (24) claims 1,9,13,15,17,18	1-5,7-12
Y	EP 0 276 177 A (SUMITOMO CHEM IND) 27 July 1988 (1988-07-27) cited in the application Tabelle 1, Seite 14, Verbindungen (19) und (11) claims 1,2,6-9	1-5,7-12
A,P	WO 03 074491 A (EHRENFREUND JOSEF; TOBLER HANS (CH); WALTER HARALD (CH); SYNGENTA) 12 September 2003 (2003-09-12) claims 1,9,10; table 4	1-6,9-12
A,P	WO 03 066610 A (MAULER-MACHNIK ASTRID; DUNKEL RALF (DE); KUGLER MARTIN (DE); JAETS) 14 August 2003 (2003-08-14) claims 1-17; example 1; tables A,B	1-6,9-12

INTERNATI NAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/11392

YO

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 0208197	A	31-01-2002	DE	10122447 A1	18-04-2002
			AU	7848001 A	05-02-2002
			BR	0112676 A	24-06-2003
			CN	1444564 T	24-09-2003
			WO	0208197 A1	31-01-2002
			EP	1305292 A1	02-05-2003
			HU	0301661 A2	28-08-2003
EP 0371950	A	06-06-1990	US	5045554 A	03-09-1991
			AT	116973 T	15-01-1995
			AU	616579 B2	31-10-1991
			AU	4559489 A	07-06-1990
			BR	8906011 A	19-06-1990
			CA	2004013 A1	29-05-1990
			CN	1043127 A ,B	20-06-1990
			DD	289695 A5	08-05-1991
			DE	68920556 D1	23-02-1995
			DE	68920556 T2	22-06-1995
			DK	598589 A	30-05-1990
			EP	0371950 A2	06-06-1990
			ES	2017611 T3	01-05-1995
			HU	52079 A2	28-06-1990
			IL	92482 A	13-05-1993
			IN	170285 A1	07-03-1992
			JP	1728467 C	19-01-1993
			JP	2184680 A	19-07-1990
			JP	4015228 B	17-03-1992
			KR	9201764 B1	02-03-1992
			MX	164509 B	21-08-1992
			NO	894738 A	30-05-1990
			NZ	231552 A	21-12-1990
			PL	159541 B1	31-12-1992
			PT	92419 A ,B	31-05-1990
			RO	106740 B1	30-06-1993
			SU	1831284 A3	30-07-1993
			RU	2002418 C1	15-11-1993
			TR	24136 A	04-04-1991
			YU	225089 A1	30-04-1991
			ZA	8909072 A	28-11-1990
			BG	60369 B2	14-10-1994
			ZW	15789 A1	18-04-1990
WO 02059086	A	01-08-2002	CA	2433819 A1	01-08-2002
			CZ	20032018 A3	15-10-2003
			WO	02059086 A1	01-08-2002
			EP	1355879 A1	29-10-2003
			HU	0302581 A2	28-11-2003
EP 0591699	A	13-04-1994	DE	4231518 A1	24-03-1994
			CA	2106497 A1	22-03-1994
			EP	0591699 A1	13-04-1994
			JP	6211769 A	02-08-1994
EP 0315502	A	10-05-1989	JP	1230579 A	14-09-1989
			JP	2638966 B2	06-08-1997
			JP	1230569 A	14-09-1989
			AU	607274 B2	28-02-1991
			AU	2470088 A	11-05-1989

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 03/11392

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0315502	A		BR 8805744 A	18-07-1989
			DE 3881478 D1	08-07-1993
			DE 3881478 T2	16-09-1993
			DK 617388 A	07-05-1989
			EP 0315502 A1	10-05-1989
			ES 2054846 T3	16-08-1994
			IE 60893 B1	24-08-1994
			JP 2131481 A	21-05-1990
			JP 2638968 B2	06-08-1997
			KR 9711303 B1	09-07-1997
			US 4877441 A	31-10-1989
			US 5004816 A	02-04-1991
			CA 1327583 C	08-03-1994
EP 0276177	A	27-07-1988	JP 2552846 B2	13-11-1996
			JP 63307865 A	15-12-1988
			AU 598624 B2	28-06-1990
			AU 1037388 A	21-07-1988
			DE 3868076 D1	12-03-1992
			EP 0276177 A1	27-07-1988
			US 4837242 A	06-06-1989
			JP 2623629 B2	25-06-1997
			JP 63307859 A	15-12-1988
WO 03074491	A	12-09-2003	WO 03074491 A1	12-09-2003
WO 03066610	A	14-08-2003	DE 10204391 A1	14-08-2003
			WO 03066610 A1	14-08-2003

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

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Researchierter Mindestprüfstoß (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D A01N

Researchierte aber nicht zum Mindestprüfstoß gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die researchierten Gebiete fallen

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Bez. Anspruch Nr.
Y	WO 02 08197 A (MAULER MACHNIK ASTRID; DUNKEL RALF (DE); KUGLER MARTIN (DE); RIECK) 31. Januar 2002 (2002-01-31) Ansprüche 1-4,15-18; Beispiele 60,61	1-6,8-12
Y	EP 0 371 950 A (MONSANTO CO) 6. Juni 1990 (1990-06-06) Ansprüche 1,15,21; Beispiele 27,28	1-6,9-12
Y	WO 02 059086 A (WALTER HARALD; TRAH STEPHAN (CH); SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)) 1. August 2002 (2002-08-01) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,10-13; Tabelle 4	1-12

-/-

☒ 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" Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

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

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, 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 worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

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

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung: die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit 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

17. Februar 2004

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts

25/02/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tlx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Hass, C

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationale Alkylsilole

PCT/EP 03/11392

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Bez. Anspruch Nr.
Y	EP 0 591 699 A (BASF AG) 13. April 1994 (1994-04-13) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,5-8; Tabelle 6	1-6,9-12
Y	EP 0 315 502 A (SUMITOMO CHEMICAL CO) 10. Mai 1989 (1989-05-10) in der Anmeldung erwähnt Tabelle 1, Seite 13, Verbindung (24) Ansprüche 1,9,13,15,17,18	1-5,7-12
Y	EP 0 276 177 A (SUMITOMO CHEM IND) 27. Juli 1988 (1988-07-27) in der Anmeldung erwähnt Tabelle 1, Seite 14, Verbindungen (19) und (11) Ansprüche 1,2,6-9	1-5,7-12
A,P	WO 03 074491 A (EHRENFREUND JOSEF; TOBLER HANS (CH); WALTER HARALD (CH); SYNGENTA) 12. September 2003 (2003-09-12) Ansprüche 1,9,10; Tabelle 4	1-6,9-12
A,P	WO 03 066610 A (MAULER-MACHNIK ASTRID; DUNKEL RALF (DE); KUGLER MARTIN (DE); JAETS) 14. August 2003 (2003-08-14) Ansprüche 1-17; Beispiel 1; Tabellen A,B	1-6,9-12

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internat. Abdruck

PCT/EP 03/11392

42

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 0208197	A	31-01-2002	DE	10122447 A1	18-04-2002
			AU	7848001 A	05-02-2002
			BR	0112676 A	24-06-2003
			CN	1444564 T	24-09-2003
			WO	0208197 A1	31-01-2002
			EP	1305292 A1	02-05-2003
			HU	0301661 A2	28-08-2003
EP 0371950	A	06-06-1990	US	5045554 A	03-09-1991
			AT	116973 T	15-01-1995
			AU	616579 B2	31-10-1991
			AU	4559489 A	07-06-1990
			BR	8906011 A	19-06-1990
			CA	2004013 A1	29-05-1990
			CN	1043127 A , B	20-06-1990
			DD	289695 A5	08-05-1991
			DE	68920556 D1	23-02-1995
			DE	68920556 T2	22-06-1995
			DK	598589 A	30-05-1990
			EP	0371950 A2	06-06-1990
			ES	2017611 T3	01-05-1995
			HU	52079 A2	28-06-1990
			IL	92482 A	13-05-1993
			IN	170285 A1	07-03-1992
			JP	1728467 C	19-01-1993
			JP	2184680 A	19-07-1990
			JP	4015228 B	17-03-1992
			KR	9201764 B1	02-03-1992
			MX	164509 B	21-08-1992
			NO	894738 A	30-05-1990
			NZ	231552 A	21-12-1990
			PL	159541 B1	31-12-1992
			PT	92419 A , B	31-05-1990
			RO	106740 B1	30-06-1993
			SU	1831284 A3	30-07-1993
			RU	2002418 C1	15-11-1993
			TR	24136 A	04-04-1991
			YU	225089 A1	30-04-1991
			ZA	8909072 A	28-11-1990
			BG	60369 B2	14-10-1994
			ZW	15789 A1	18-04-1990
WO 02059086	A	01-08-2002	CA	2433819 A1	01-08-2002
			CZ	20032018 A3	15-10-2003
			WO	02059086 A1	01-08-2002
			EP	1355879 A1	29-10-2003
			HU	0302581 A2	28-11-2003
EP 0591699	A	13-04-1994	DE	4231518 A1	24-03-1994
			CA	2106497 A1	22-03-1994
			EP	0591699 A1	13-04-1994
			JP	6211769 A	02-08-1994
EP 0315502	A	10-05-1989	JP	1230579 A	14-09-1989
			JP	2638966 B2	06-08-1997
			JP	1230569 A	14-09-1989
			AU	607274 B2	28-02-1991
			AU	2470088 A	11-05-1989

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationale Abkürzungen

PCT/EP 03/11392

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0315502 A		BR 8805744 A	18-07-1989
		DE 3881478 D1	08-07-1993
		DE 3881478 T2	16-09-1993
		DK 617388 A	07-05-1989
		EP 0315502 A1	10-05-1989
		ES 2054846 T3	16-08-1994
		IE 60893 B1	24-08-1994
		JP 2131481 A	21-05-1990
		JP 2638968 B2	06-08-1997
		KR 9711303 B1	09-07-1997
		US 4877441 A	31-10-1989
		US 5004816 A	02-04-1991
		CA 1327583 C	08-03-1994
EP 0276177 A	27-07-1988	JP 2552846 B2	13-11-1996
		JP 63307865 A	15-12-1988
		AU 598624 B2	28-06-1990
		AU 1037388 A	21-07-1988
		DE 3868076 D1	12-03-1992
		EP 0276177 A1	27-07-1988
		US 4837242 A	06-06-1989
		JP 2623629 B2	25-06-1997
		JP 63307859 A	15-12-1988
WO 03074491 A	12-09-2003	WO 03074491 A1	12-09-2003
WO 03066610 A	14-08-2003	DE 10204391 A1	14-08-2003
		WO 03066610 A1	14-08-2003

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2003/011392



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference LEA36186-WO	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/011392	International filing date (day/month/year) 15 October 2003 (15.10.2003)	Priority date (day/month/year) 28 October 2002 (28.10.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 277/56, A01N 43/78		
Applicant BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. 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 amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

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

Date of submission of the demand 19 February 2004 (19.02.2004)	Date of completion of this report 16 June 2004 (16.06.2004)
Name and mailing address of the IPEA/EP Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. PCT/EP2003/011392

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 at least some of the claims does not appear to meet the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. does not appear to be novel and/or to involve an inventive step (see international search report, in particular the documents cited X and/or Y and corresponding claim references).

PCT-ANTRAG

1/8

LEA36186-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 30.09.2003 10:50:19 AM

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/101 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.92 (aktualisiert 01.04.2003)
0-5	Antragsersuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LEA36186-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	THIAZOL- (BI) CYCLOALKYL-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)	DUNKEL, Ralf
III-1-5	Anschrift:	Krischerstr. 22 D-40789 Monheim Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

46

III-2	Anmelder und/oder Erfinder	
III-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-2-2	Anmelder für	Nur US
III-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	RIECK, Heiko
III-2-5	Anschrift:	9, rue Claude Monet F-69110 Ste. Foy-lès-Lyon Frankreich
III-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-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)	ELBE, Hans-Ludwig
III-3-5	Anschrift:	Dasnöckel 59 D-42329 Wuppertal 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)	GREUL, Jörg, Nico
III-4-5	Anschrift:	Am Sandberg 30a D-42799 Leichlingen 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)	WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike
III-5-5	Anschrift:	Oberer Markenweg 85 D-56566 Neuwied Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-6	Anmelder und/oder Erfinder	
III-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-6-2	Anmelder für	Nur US
III-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KUCK, Karl-Heinz
III-6-5	Anschrift:	Pastor-Löh-Str. 30 a D-40764 Langenfeld Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-7	Anmelder und/oder Erfinder	
III-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-7-2	Anmelder für	Nur US
III-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DAHMEN, Peter
III-7-5	Anschrift:	Altebrücker Str. 61 D-41470 Neuss Deutschland
III-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-7-7	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:	Law and Patents Patents and Licensing D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	02143029033
IV-1-4	Telefaxnr.	02143053482

V	Bestimmung von Staaten	
V-1	Regionales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AP: GE 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 HU IE IT LU MC NL PT RO SE SI 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 MZ NI NO NZ OM PG PH PL PT RO RU SC SD SE SG SK SL SY TJ TM TN TR TT TZ UA UG US UZ VC VN YU ZA ZM ZW
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-5	Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen Zusätzlich zu den unter Punkten V-1, V-2 and 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 ausgenommen werden	KEINE

VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-1-1	Anmeldedatum	28 Oktober 2002 (28.10.2002)	
VI-1-2	Nummer	10250110.6	
VI-1-3	Staat	DE	
VII-1	Gewählte Internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VIII	Erklärungen	Anzahl der Erklärungen	
VIII-1	Erklärung hinsichtlich der Identität des Erfinders	-	
VIII-2	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten	1	
VIII-3	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen	1	
VIII-4	Erfindererklärung (nur im Hinblick auf die Bestimmung der Vereinigten Staaten von Amerika)	-	
VIII-5	Erklärung hinsichtlich unschädlicher Offenbarungen oder Ausnahmen von der Neuheitschädlichkeit	-	

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 a 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 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, DUNKEL, Ralf
VIII-2-1 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, RIECK, Heiko
VIII-2-1 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, ELBE, Hans-Ludwig
VIII-2-1 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, GREUL, Jörg, Nico
VIII-2-1 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike
VIII-2-1 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, KUCK, Karl-Heinz
VIII-2-1 (II)		BAYER AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, DAHMEN, Peter
VIII-2-1 (III)		auf Grund einer Vereinbarung zwischen BAYER AG und BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT vom 24 Oktober 2002 (24.10.2002)
VIII-2-1 (IX)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten (mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika)

51

VIII-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 III und 51bis.1 Absatz a Ziffer III): Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, die Priorität der früheren Anmeldung Nr. 10250110.6 zu beanspruchen:
VIII-3-1 (vi)		auf Grund einer Vereinbarung zwischen BAYER AG und BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT vom 08 Juli 2003 (08.07.2003)
VIII-3-1 (ix)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten

52

IX	Kontrollliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-1	Antrag (inklusive Erklärungsblätter)	8	-
IX-2	Beschreibung	39	-
IX-3	Ansprüche	8	-
IX-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
IX-5	Zeichnung(en)	0	-
IX-7	INSGESAMT	56	
	Beigelegte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigelegt	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
IX-9	Original einer gesonderten Vollmacht	✓	-
IX-13	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1	-
IX-17	PCT-EASY-Diskette	-	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		
X-1-1	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BADER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT	

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

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser Internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en):	
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	Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr aufgeschoben	

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

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

1/n

Original (para PRESENTAR) – Impreso el 30.09.2003 10:50:19 AM

VIII-2-1	Declaración: Autorización para solicitar y obtener una patente Declaración con relación a la autorización del solicitante, de solicitar y obtener en el momento de la fecha de solicitud internacional una patente (reglas 4.17 ítem II y 51bis. 1 párrafo a ítem II), para el caso, que una declaración de acuerdo con la regla 4.17 ítem IV no sea pertinente: Nombre:	con relación a esta solicitud internacional BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT esta en poder de lo citado a continuación, autorizado para solicitar y obtener una patente:
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, DUNKEL, Ralf
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, RIECK, Heiko
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, ELBE, Hans-Ludwig
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, GREUL, Jörg, Nico
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, WACHENDORF-NEUMANN, Ulrike
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, KUCK, Karl-Heinz
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, DAHMEN, Peter
VIII-2-1 (vii)		con base en un acuerdo entre BAYER AG y BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT del 24 de octubre de 2002 (24/10/2002)
VIII-2-1 (ix)	Esta declaración se emite en vista de:	todos los estados designados (a excepción de los Estados Unidos de América)

VIII-3-1	Declaración: Autorización, para reivindicar prioridad Declaración con relación a la autorización del solicitante, de reivindicar una prioridad, en el momento de la fecha de solicitud internacional, en los casos en los que el solicitante ya no sea el solicitante de la solicitud anterior, de la cual se reivindica prioridad, o en los casos, en los que el nombre del solicitante se haya modificado desde la presentación de la solicitud anterior (reglas 4.17 ítem III y 51bis. 1 párrafo a ítem III): Nombre:	con relación a esta solicitud internacional BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT esta en poder de lo citado a continuación, autorizado para reivindicar prioridad de la solicitud anterior No. 10250110.6:
VIII-3-1 (III)		con base en un acuerdo entre BAYER AG y BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT del 08 de julio de 2003 (08/07/2003)
VIII-3-1 (IX)	Esta declaración se emite en vista de:	todos los estados designados

Traducción

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

55

Referencia del expediente del agente o solicitante LE A 36 186 – WO	PARA ACTUACIONES ADICIONALES	Ver notificación de Transmisión del Reporte de Examen Preliminar (Formato PCT/IPEA416)
Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/011392	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 15/10/2003	Fecha de prioridad (día/mes/año) 28/10/2002
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC C07D 277/56, A01N 43/78		
Solicitante BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

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 807 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 19/02/2004	Fecha de terminación de este reporte 16/06/2004
Nombre y dirección de correo de la autoridad encargada del examen preliminar Fax.	Funcionario Autorizado Teléfono No.

Formato PCT/IPEA/409 (portada) (Julio 1998)

I. Base del Informe

La base de este informe es la solicitud como se presentó originalmente.

V. Declaración motivada según la Regla 66.2(a)(II) en cuanto a la novedad, el nivel inventivo y la aplicación

A la luz de los documentos citados en el informe de búsqueda internacional, se considera que la invención como se define en al menos algunas de las reivindicaciones no parece cumplir con los criterios mencionados en el Artículo 33(1) del PCT, es decir, no parece ser novedosa y/o comprender un nivel inventivo (ver informe de búsqueda internacional, en particular los documentos citados con X y/o Y y las correspondientes referencias a reivindicaciones).

TIAZOL-(B)CICLOALQUIL-CARBOXANILIDAS.

Inventores.-

Solicitante.- Bayer CropScience AG, entidad alemana.

Residencia.- Alfred-Nobel-Straß 50, D-40789, Monheim, Alemania.

κ

Le A 36 Le A 36 186-COLOMBIA

TIAZOL-(B)CICLOALQUIL-CARBOXANILIDAS.

Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevas tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra los microorganismos indeseados.

5

Antecedentes de la invención

Se sabe ya que tiene propiedades fungicidas un gran número de tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas (véanse, por ejemplo, las publicaciones EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, EP-A 0 315 502 y EP-A 0 276 177). De este modo se han dado ya a conocer, por ejemplo, las siguientes tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas:

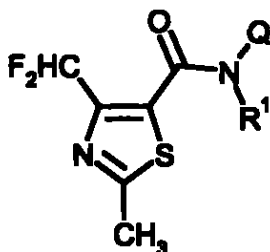
10 2-amino-*N*-(2-ciclohexilfenil)-4-(trifluórmetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida y 2-amino-*N*-(2-ciclopentilfenil)-4-(trifluórmetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida por la publicación EP-A 0 589 301, *N*-(2-ciclohexilfenil)-2-metil-4-(trifluórmetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida y *N*-(2-ciclopentilfenil)-2-metil-4-(trifluórmetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida por la publicación EP-A 0 545 099, 2-metil-4-(trifluórmetil)-*N*-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1*H*-inden-4-il)-

15 1,3-tiazol-5-carboxamida por la publicación EP-A 0 276 177 y 2-metil-4-(trifluórmetil)-*N*-(1,1,3-trimetil-1,3-dihidro-2-benzofuran-4-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida por la publicación EP-A 0 315 502. La actividad de estos productos es buena pero sin embargo deja mucho que desear en muchos casos, por ejemplo con ocasión de cantidades de aplicación bajas.

20

Descripción detallada de la invención

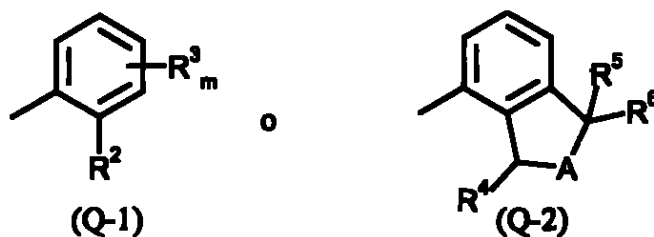
Se han encontrado ahora nuevas tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I)



(I)

en la que

Q significa un grupo



- R¹ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ o -CH₂NR¹⁰R¹¹,
- R² significa, cicloalquilo con 3 a 12 átomos de carbono, cicloalquenilo con 3 a 12 átomos de carbono, bicicloalquilo con 6 a 12 átomos de carbono o bicicloalquenilo con 6 a 12 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno, por ciano, por hidroxí, por alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R³ significa flúor, cloro, bromo o metilo,
- m significa 0, 1, 2, 3 o 4,

- A significa O (oxígeno) o CR¹²,
- R⁴, R⁵, R⁶ y R¹² significan, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo o etilo,
- R⁷ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo o 4-(difluórmethyl)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo,
- R⁸ y R⁹ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R⁸ y R⁹ forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹³,
- R¹⁰ y R¹¹ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo

- 5 -

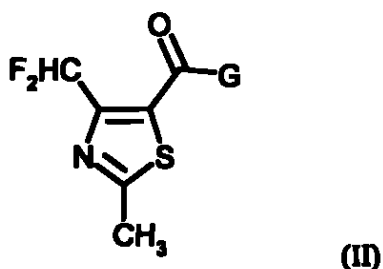
R^{10} y R^{11} forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el

5 heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{13} ,

R^{13} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

Además, se ha encontrado, que se obtienen las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), si

10 A) se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílico de la fórmula (II)



en la que

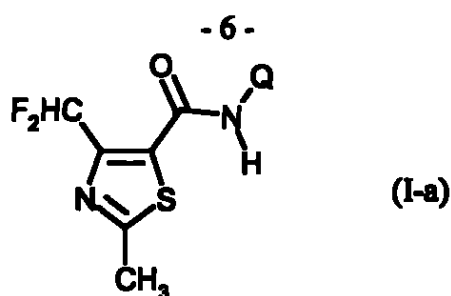
G significa halógeno, hidroxilo o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en una primera etapa con derivados de anilina de la fórmula (III)

15 H_2N-Q (III)

en la que

Q tiene los significados anteriormente indicados,

en presencia de un agente aceptor de ácido y en presencia de un diluyente y los productos, obtenidos de este modo, de la fórmula (I-a)



en la que

Q tiene los significados anteriormente indicados,

se hacen reaccionar, en caso dado, en una segunda etapa con un halogenuro de la

5 fórmula (IV)



en la que

10 R^{1-1} significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, 15 halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-COR^7$, $-CONR^8R^9$ o $-CH_2NR^{10}R^{11}$,

R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} y R^{11} tienen los significados anteriormente indicados y

X significa cloro, bromo o yodo,

en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

20 Finalmente, se ha encontrado que las nuevas tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I) tienen propiedades microbidas muy buenas y que pueden emplearse para la lucha contra microorganismos indeseados tanto en la protección de las plantas

- 7 -

como también en la protección de los materiales.

Sorprendentemente, las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), según la invención, presentan una actividad fungicida sensiblemente mejor que la de los productos activos, conocidos con anterioridad, de constitución similar, con la misma
5 dirección de actividad.

Las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (I). Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos indicados en las fórmulas anteriores y que se citarán seguidamente, se explican a continuación.

- 10 R¹ preferentemente significa hidrógeno; alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono,
15 halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ o -CH₂NR¹⁰R¹¹.
- 20 R¹ de forma especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo,
25 ciclohexilo, trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, difluormetilsulfanilo, difluorclorometilsulfanilo, trifluormetilsulfanilo, trifluormetilsulfinilo,

- 8 -

trifluórmethylsulfonilo, trifluórmethylmetoximetilo; $-\text{COR}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$.

R^1 de forma muy especialmente preferente significa hidrógeno; metilo, metoximetilo o $-\text{COR}^7$.

R^2 preferentemente significa, cicloalquilo con 3 a 12 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 12 átomos de carbono sustituido, cicloalqueno con 3 a 12 átomos de carbono, bicicloalquilo con 6 a 12 átomos de carbono o bicicloalqueno con 6 a 12 átomos de carbono sustituidos respectivamente, en caso dado de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por hidroxilo, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo .

R^2 de forma especialmente preferente significa, cicloalquilo con 3 a 10 átomos de carbono, cicloalqueno con 3 a 10 átomos de carbono, bicicloalquilo con 6 a 10 átomos de carbono o bicicloalqueno con 6 a 10 átomos de carbono sustituidos respectivamente, en caso dado de una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por hidroxilo, por metilo, por etilo, por n- o iso-propilo, por n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o iso-propoxi, por n-, iso-, sec.- o terc.-butoxi, por trifluórmethyl, por difluórmethyl, por triclorometilo, por difluorclorometilo, por trifluórmethylmetoxi, por difluórmethylmetoxi, por triclorometoxi, por difluorclorometoxi.

R^2 de forma muy especialmente preferente significa, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, biciclo[4.1.0]heptilo, biciclo[2.2.1]heptilo sustituidos respectivamente, desde una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por iso-

propilo, por terc.-butilo, por metoxi, por etoxi, por iso-propoxi, por terc.-butoxi, por trifluórmethyl, por trifluórmethyl.

- R^3 preferentemente significa flúor, bromo o metilo.
- R^3 de forma especialmente preferente significa flúor o metilo.
- 5 m preferentemente significa 0, 1, 2 o 3.
- m de forma especialmente preferente significa 0, 1 o 2.
- A preferentemente significa O (oxígeno).
- A preferentemente significa CR^{12} .
- R^4 preferentemente significa metilo o etilo.
- 10 R^4 de forma especialmente preferente significa metilo.
- R^5 y R^6 significan preferentemente, de manera respectiva, metilo.
- R^7 preferentemente significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo o 4-(difluórmethyl)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo.
- 15 R^7 de forma especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, terc.-butoxi, ciclopropilo; trifluórmethyl, trifluórmethyl o 4-(difluórmethyl)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo.
- R^7 de forma muy especialmente preferente significa hidrógeno o 4-(difluórmethyl)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo.
- 20 R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo

- 10 -

con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

5 R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, preferentemente, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo, substituido, en caso dado, desde una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, 10 pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{13} ,

R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, 15 ciclohexilo; trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, trifluormetoximetilo.

R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, de forma especialmente preferente un heterociclo saturado, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina substituidos respectivamente, en caso dado, de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes 20 por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, pudiendo estar substituida la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógeno por R^{13} .

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 25 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

- R^{10} y R^{11} forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, preferentemente un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo
5 contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más no contiguos de la serie formada por oxígeno, por azufre o por NR^{13} .
- R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo,
10 ciclohexilo; trifluórmétilo, triclorometilo, trifluóretilo, trifluórmétoximetilo.
- R^{10} y R^{11} forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, de forma especialmente preferente un heterociclo saturado de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, substituidos respectivamente, en caso dado de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por
15 flúor, por cloro, por bromo o por metilo, pudiendo estar substituida la piperazina en el segundo átomos de nitrógeno por R^{13} .
- R^{12} preferentemente significa hidrógeno o metilo.
- R^{12} de forma especialmente preferente significa hidrógeno.
- R^{13} preferentemente significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.
- 20 R^{13} de forma especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo.
- Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), en la que R^1 significa hidrógeno.
- Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula
25 (I), en la que R^1 significa metilo.
- Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula

(I), en la que R^1 significa -CHO.

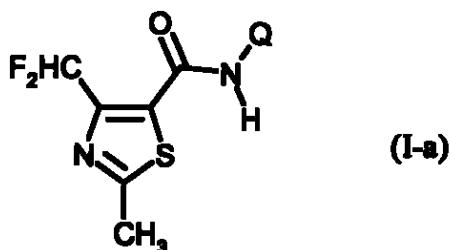
Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), en la que R^1 significa metilcarbonilo (acetilo).

Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula
5 (I), en la que Q significa Q-1 y R^2 significa biciclo[2.2.1]heptilo (norbornanilo).

Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), en la que Q significa Q-1 y m significa 0.

Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), en la que Q significa Q-1, m significa 1 y R^3 significa flúor o metilo.

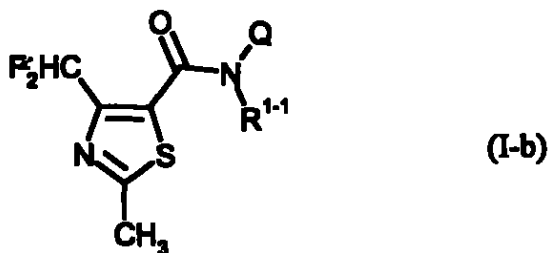
10 Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-a)



en la que

Q tiene los significados anteriormente indicados.

15 Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-b)



en la que

Q tiene los significados anteriormente indicados,

- 13 -

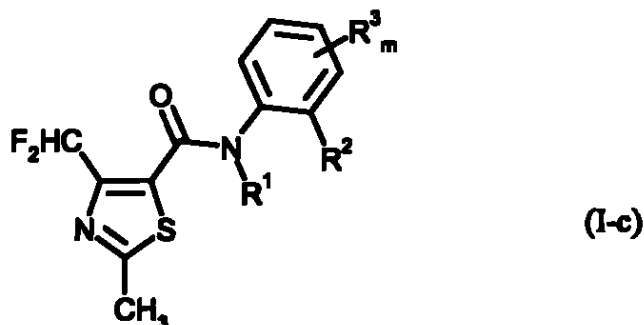
- R¹⁻¹** significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,
- 10 **R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹** tienen los significados anteriormente indicados.
- R¹⁻¹** preferentemente significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^7$,
- 20 $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$.
- R¹⁻¹** de forma especialmente preferente significa metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluórometilo, triclorometilo, trifluóretilo,
- 25

- 14 -

difluórometilsulfanilo, difluorchlormetilsulfanilo, trifluórometilsulfanilo, trifluórometilsulfinilo, trifluórometilsulfonilo, trifluórometoximetilo; $-\text{COR}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$.

R^{1-1} de forma muy especialmente preferente significa metilo o $-\text{COR}^7$.

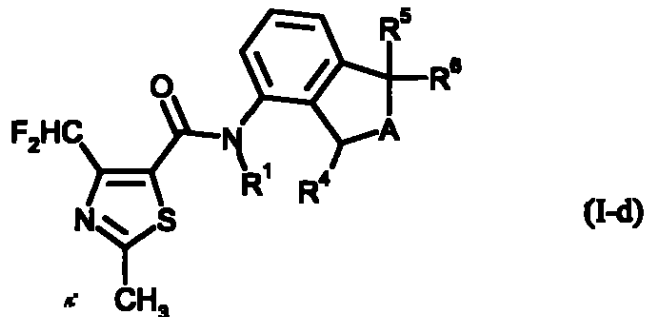
5 Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-c)



en la que

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

10 Además, son preferentes las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-d)



en la que

A , R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados anteriormente indicados.

15 Las definiciones preferentes, especialmente preferentes y muy especialmente preferentes de los restos R^1 hasta R^{13} , Q, m y A deben aplicarse, de manera correspondiente, a los compuestos de las fórmulas (I-a), (I-b), (I-c) y (I-d).

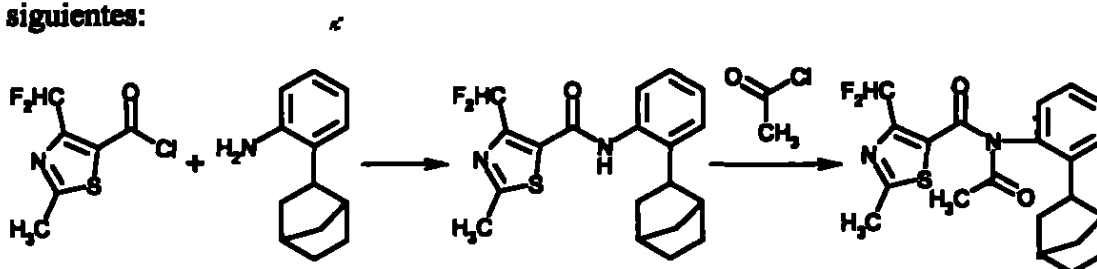
Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados, tales como alquilo o alquenilo, incluso en combinación con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, pueden ser en tanto en cuanto sea posible, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

5 Los restos sustituidos, en caso dado, pueden estar mono o polisustituidos, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en el caso de las polisustituciones.

Los restos sustituidos por halógeno, tal como por ejemplo halógenoalquilo están mono o polialogenados. En el caso de varias halogenaciones, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. En este caso halógeno significa flúor, cloro, bromo y
10 yodo, especialmente significan flúor, cloro y bromo.

Las definiciones de los restos o bien las explicaciones dadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes pueden combinarse sin embargo también arbitrariamente entre sí, es decir entre los intervalos respectivos y los intervalos preferentes. Estas son válidas para los productos finales así como, de manera
15 correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios. Además pueden suprimirse también definiciones individuales.

Si se emplean el cloruro de 4-(difluormetil)-2-metil-1,3-tiazol-5-carbonilo y la 2-biciclo[2.2.1]hept-2-ilanilina como productos de partida, en la primera etapa y, además cloruro de acetilo como producto de partida en la segunda etapa, podrá representarse el
20 desarrollo del procedimiento A) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguientes:



Explicaciones del procedimiento y de los productos intermedios

Los derivados de los ácidos carboxílicos, necesarios como productos de partida en la primera etapa del procedimiento A) según la invención están definidos, en general, por medio de la fórmula (II). En esta fórmula G significa, preferentemente, cloro, bromo, hidroxilo, metoxi o etoxi, de forma especialmente preferente significa cloro, 5 hidroxilo o metoxi, de forma muy especialmente preferente significa cloro.

Los derivados de los ácidos carboxílicos de la fórmula (II) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse las publicaciones EP-A 0 545 099 y EP-A 0 589 313).

Los derivados de anilinas, necesarios como componentes de la reacción en la 10 primera etapa para la realización del procedimiento A) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (III). En esta fórmula Q tiene, preferentemente uno de los significados Q-1 y Q-2.

Los derivados de anilina de la fórmula (III) son conocidos y/o pueden prepararse según métodos conocidos (véanse por ejemplo las publicaciones EP-A 0 545 099 y EP- 15 A 0 589 301 en el caso de Q-1, EP-A 0 654 464, EP-A 0 315 502 y EP-A 0 280 275 en el caso de Q-2).

Los compuestos de la fórmula (I-a), empleados en la realización del procedimiento A), según la invención, en la segunda etapa, constituyen un subgrupo de las tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), según la invención y, por lo 20 tanto, constituyen, igualmente, un objeto de esta solicitud.

Los halogenuros, necesarios para la realización del procedimiento A), según la invención, como componentes de la reacción en la segunda etapa, están definidos, en general, por medio de la fórmula (IV). En esta fórmula, Q tiene, preferentemente, uno de los significados Q-1 y Q-2. En este caso R^{1-1} tiene preferentemente, de forma 25 especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente, aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente

preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los productos de la fórmula (I-b) según la invención. Preferentemente X significa cloro o bromo.

Los halogenuros de la fórmula (III) son productos químicos para síntesis
5 conocidos.

Como aceptores de ácido entran en consideración, en la realización de la primera etapa del procedimiento A), según la invención, todas las bases inorgánicas u orgánicas, usuales para este tipo de reacciones. Preferentemente pueden emplearse, hidróxidos de metales alcalinotérreos o de metales alcalinos, tales como, por ejemplo, hidróxido de
10 sodio, hidróxido de calcio, hidróxido de potasio o incluso hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos tales como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-
15 dimetilnilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU). No obstante es posible, también, trabajar sin disolvente adicional, o emplear el aminocomponente en un exceso, de modo que actúe, simultáneamente, como agente aceptor de ácido.

Como diluyentes entran en consideración en la realización de la primera etapa
20 del procedimiento A) según la invención, respectivamente todos los disolventes orgánicos inertes, usuales. Preferentemente, pueden emplearse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano,
25 diclorooctano o triclorooctano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-

- 18 -

dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido; sulfonas, tal
5 como sulfolano.

Las temperaturas de la reacción en la realización de la primera etapa del procedimiento A) según la invención pueden variar, respectivamente, dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendida entre 0°C y 140°C, preferentemente a temperaturas comprendidas entre 10°C y 120°C.

10 En la realización de la primera etapa del procedimiento A) según la invención se trabaja, en general, respectivamente, bajo presión atmosférica. No obstante es posible, también, trabajar, respectivamente, bajo presión más elevada o a presión más reducida.

En la realización de la primera etapa del procedimiento A) según la invención se emplean, por 1 mol del derivado de ácido carboxílico de la fórmula (II), en general 1
15 mol o incluso un exceso de derivado de anilina de la fórmula (III) así como desde 1 hasta 3 moles de agentes aceptor de ácido. No obstante, es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. la elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera, que la mezcla de la reacción se combina con agua, se separa la fase orgánica y se concentra por evaporación a presión
20 reducida, tras el secado. El residuo remanente puede liberarse de las impurezas presentes todavía, eventualmente, según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

Como diluyentes para la realización de la segunda etapa del procedimiento A) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A
25 estos pertenecen, preferentemente, los 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-terc.-butiléter, metil-terc.-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-
5 dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformamida, N-metilpirrolidona o hexametilfosforotriamida..

La segunda etapa del procedimiento A) según la invención se llevan a cabo en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las
10 bases inorgánicas u orgánicas usuales. A estas pertenecen, preferentemente, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, 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,
15 acetato de amonio, 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-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiridina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN), diazabicycloundeceno (DBU).

20 Las temperaturas de la reacción en la realización de la segunda etapa del procedimiento A) según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, preferentemente entre 20°C y 110°C.

- 20 -

En la realización de la segunda etapa del procedimiento A) según la invención se trabaja, en general, respectivamente, bajo presión atmosférica. No obstante es posible, también, trabajar, respectivamente, bajo presión más elevada o a presión más reducida.

Para la realización de la segunda etapa del procedimiento A) según la invención,
5 para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la tiazolilbifenilamida de la fórmula (II), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de halogenuro de la fórmula (III).

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

Los agentes fungicidas se emplean en la protección de las plantas para la lucha contra los plasmodioforomicetes, oomicetes, quitridiomicetes, zigomicetes, ascomicetes, basidiomicetes y deuteromicetes.

Los agentes bactericidas se emplean en la protección de las plantas para combatir
15 pseudomonadaceos, rizobiaceos, enterobacteriaceos, corinebacteriaceos y estreptomicetaceos.

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:

20 tipos de xantomonas, tales como por ejemplo Xanthomonas campestris pv. oryzae;
tipos pseudomonas, tales como por ejemplo Pseudomonas syringae pv. lachrymans;
tipos de erwinia, tales como por ejemplo Erwinia amylovora;
tipos de pitium, tal como por ejemplo Pythium ultimum;
tipos de fitofthora, tal como por ejemplo Phytophthora infestans;
25 tipos de pseudoperonospora, tales como por ejemplo Pseudoperonospora humuli o Pseudoperonospora cubensis;

- tipos de plasmopara, tal como por ejemplo *Plasmopara viticola*;
- tipos de bremia, tal como por ejemplo *Bremia lactucae*;
- tipos de peronospora, tales como por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
- tipos de erisife, tal como por ejemplo *Erysiphe graminis*;
- 5 tipos de esfaeroteca, tal como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginosa*;
- tipos de podosphaera, tal como por ejemplo *Podosphaera leucotricha*;
- tipos de venturia, tal como por ejemplo *Venturia inaequalis*;
- tipos de pirenofora, tal como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *P. graminea*;
- (forma de conidios, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);
- 10 tipos de coeliobolus, tal como por ejemplo *Cochliobolus sativus*
- (forma de conidios, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);
- tipos de uromices, tal como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;
- tipos de pucinia, tal como por ejemplo *Puccinia recondita*;
- Tipos de esclerotinia, tal como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*;
- 15 tipos de tilletia, tal como por ejemplo *Tilletia caries*;
- tipos de ustilago, tal como por ejemplo *Ustilago nuda* 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*;
- 20 tipos de botritis, tal como por ejemplo *Botrytis cinerea*;
- 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*;
- 25 tipos de pseudocercospora, tal como por ejemplo *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Los productos activos según la invención presentan también un potente efecto reforzador en las plantas. Estos son adecuados, por lo tanto, para movilizar las fuerzas de resistencia propias de las plantas contra el ataque de los microorganismos indeseables.

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

Entre los microorganismos indeseados deben entenderse en el caso presente hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Los productos según la invención pueden emplearse, por lo tanto, para generar resistencia en las plantas, dentro de un lapso de tiempo determinado a partir del tratamiento, contra el ataque debido a los patógenos citados. El lapso de tiempo, dentro del cual se provoca su resistencia, 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 plantones y semillas y del suelo.

Los productos activos según la invención son adecuados, también, para aumentar el rendimiento de las cosechas. Además tienen una toxicidad mínima y presentan una buena compatibilidad para con las plantas.

Los productos activos según la invención pueden emplearse en caso dado, en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación, también como herbicidas y microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos y bactericidas. Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios o 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 desecadas y no desecadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los
5 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,
10 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 plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los
15 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.

20 Los productos según la invención pueden emplearse en la protección de los materiales industriales contra el ataque y la destrucción debidos a los micro-organismos indeseables.

Se entenderán por materiales industriales en el presente contexto los materiales no vivos, que hayan sido elaborados para el empleo en la técnica. A modo de ejemplo los materiales técnicos, que quedarían protegidos contra las modificaciones o destrucciones
25 microbianas por medio de los productos activos según la invención, son pegamentos, colas, papel y cartón, textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de material sintético,

- 24 -

lubrificantes en frío y otros materiales. 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 puedan quedar perjudicados por la multiplicación de los micro-organismos. En el ámbito de la presente invención pueden citarse a modo de
5 materiales técnicos preferentemente pegamentos, colas, papel y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes en frío y líquidos caloportadores, de forma especialmente preferente la madera.

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

A modo de ejemplo pueden citarse los micro-organismos de los tipos siguientes:

- 15 *Alternaria*, tal como *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, tal como *Aspergillus niger*,
Chaetomium, tal como *Chaetomium globosum*,
Coniophora, tal como *Coniophora puetana*,
Lentinus, tal como *Lentinus tigrinus*,
- 20 *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*,
- 25 *Escherichia*, tal como *Escherichia coli*,
Pseudomonas, tal como *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, tal como Staphylococcus aureus.

Los productos activos pueden transformarse, en función de sus respectivas propiedades físicas y/o químicas, en las formulaciones usuales tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, granulados, aerosoles, microencapsulados en materiales polímeros y en masas de recubrimiento para semillas, así como formulaciones de nebulizado en frío y en caliente en volumen ultra-bajo (ULV).

Estas formulaciones se preparan de forma conocida, por ejemplo por mezclado de los productos activos con agentes extendedores, es decir disolventes líquidos, gases licuados, que se encuentran a presión y/o materiales de soporte sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes generadores de espuma. En el caso del empleo de agua como agente extendedor pueden emplearse también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración fundamentalmente: hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno, o alquilnaftalinas, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados. Tales como clorobencenos, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, alcoholes, tales como butanol o glicol, así como éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido así como agua. Por agentes extendedores o materiales de soporte gaseosos licuados se quieren indicar aquellos que son gaseosos a temperatura normal y bajo presión normal, por ejemplo gases propulsores para aerosol, tales como los hidrocarburos halogenados así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. Como materiales de soporte sólidos entran en consideración, por ejemplo, harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, cretas, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, o tierra de diatoméas y harinas minerales sintéticas, tales como ácido silícico altamente dispersado, óxido de aluminio y silicatos.

- 26 -

Como materiales de soporte sólido para granulados entran en consideración: por ejemplo minerales quebrados y fracciones tal como calcita, mármol, pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos constituidos a partir de harinas inorgánicas y orgánicas así como granulados constituidos a partir de material orgánico tales como serrín, cáscaras de
5 nueces de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco. Como agentes emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres de ácidos grasos polioxietilenados, éteres de alcoholes grasos polioxietilenados, por ejemplo alquilaril-poliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina. Como dispersantes entran en
10 consideración, por ejemplo lejías sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

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

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

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

Los productos activos según la invención puede presentarse como tales o en sus formulaciones también en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o
25 insecticidas conocidos, para ampliar, de este modo, por ejemplo el espectro de actividad o

- 27 -

el desarrollo de la resistencia. En muchos casos se obtienen efectos sinérgicos, es decir que la actividad de la mezcla es mayor que la actividad de los componentes individuales.

Como componentes de mezcla entran en consideración, por ejemplo, los compuestos siguientes:

- 5 Fungicidas:**
 2-fenilfenol; 8-hidroxiquinolinsulfato;
 Acibenzolar-S-metilo; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-
 potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin;
 Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-
10 isobutilo; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole;
 Bupirimate; Buthiobate; Butylamin;
 polisulfuro de calcio; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin;
 Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb;
 Chlorothalonil; Chlozolate; Clozilacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil;
15 Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram;
 Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet;
 Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol;
 Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap;
 Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon;
20 Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole;

“

- 28 -

- Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram;
Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam;
Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide;
Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil;
5 Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodio; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr;
Furcarbanil; Furmecyclox;
Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol;
Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb;
Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane;
10 Isovaledione;
Kasugamycin; Kresoxim-metilo;
Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M;
Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax;
Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin;
15 Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropilo; Noviflumuron; Nuarimol;
Ofurace; Oryastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin;
Oxyfenthin;
Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide;
Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz;
20 Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodio; Propiconazole; Propineb; Proquinazid;
Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon;
Pyroxyfur; Pyrrolnitrine;
Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur;
Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole;
25 Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-metilo; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-metilo;

- 29 -

Tolylfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide;

(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-

- 5 [(metilsulfoni)amino]-butanoamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina; 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida; 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida; 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo; Actinovate; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol; 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de
- 10 metilo; carbonato de mono potasio; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropancarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4,5]decan-3-amin; tetratiocarbonato de sodio; así como las sales de cobre y -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclورو de cobre; sulfato de cobre; Cufraneb; óxido de cobre; Mancopper; oxina de cobre.

15 **Bactericidas:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin, Oethilnon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

- 20 Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-etilo, Azocyclotin,
- 25 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus

- 30 -

thuringiensis strain EG-2348, *Bacillus thuringiensis* strain GC-91, *Bacillus thuringiensis* strain NCTC-11821, Baculoviren, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-ciclopentil-isómero,

5 Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-etilo, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-metilo), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb,

10 Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-metilo, Chlorpyrifos (-etilo), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, *Cydia*

15 *pomonella*, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (isómero 1R-trans), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran,

20 Diofenolan, Disulfoon, Docusat-sodio, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoato, Empenthrin (isómero 1R), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion,

25 Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil,

- Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocyclothrinate, Flucyclohexuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb,
- 5 Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, granulovirus, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocab, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure,
- 10 Kadethrin, nucleopoliedrovirus, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700,
- 15 Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl,
- 20 Oxydemeton-metilo, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-metilo, Parathion (-etil), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (isómero 1R-trans), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-metilo, Pirimiphos-etil, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos,
- 25 Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion,

- 32 -

- Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
 Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525,
 S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen,
 Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,
 5 Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin,
 Temephos, Temiviphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon,
 Tetramethrin, Tetramethrin (isómero 1R), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid,
 Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb,
 Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin,
 10 Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron,
 Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,
 Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii,
 WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xyllycarb,
 ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901,
 15 el compuesto 3-metil-fenil-propilcarbamato (Tsumacide Z),
 el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-
 carbonitrilo (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) y el correspondiente isómero endo (CAS-
 Reg.-Nr. 185984-60-5) (véanse las publicaciones WO-96/37494, WO-98/25923),
 así como preparados que contengan extractos vegetales de acción insecticida,
 20 nematodos, hongos o virus.

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 efectos antimicóticos muy buenos. Tienen un espectro de actividad antimicótica muy amplio,
 25 especialmente contra dermatofitos y blastomicetes, mohos y contra hongos difásicos (por ejemplo contra especies de Candida, tal como Candida albicans, Candida glabrata) así

como *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus*, tales como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton*, tal como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de microesporas, tal como *Microsporon canis* y *audouinii*. La enumeración de estos hongos no representa en modo alguno una limitación del espectro micótico a ser
5 considerado sino que tiene únicamente un carácter orientativo.

Los productos activos se pueden emplear en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas tales como soluciones, suspensiones, polvos pulverizables, pastas, polvos solubles, agentes de empolvado y granulados listos para su utilización. La aplicación se efectúa de manera usual, por ejemplo
10 mediante regado, pulverizado, empolvado, esparcido, espolvoreado, espumado, aplicación a brocha etc. Además es posible aplicar los productos activos según el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar en el suelo la preparación del producto activo o el propio producto activo. Igualmente pueden tratarse las semillas de las plantas.

Cuando se emplean los productos activos según la invención como fungicidas las
15 cantidades de aplicación pueden variar dentro de amplios límites según el tipo de la aplicación. Cuando se tratan las partes de las plantas, las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran, 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 del producto activo se encuentran, en general, entre 0,001 y 50 g por kilogramo de
20 semillas, preferentemente entre 0,01 y 10 g por kilogramo de semillas. En el caso del tratamiento del terreno, las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran, en general, entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 1 y 5.000g /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
25 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
5 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
10 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, periodo de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades
15 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
20 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 preferentemente, según la invención, pertenecen todas
25 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
5 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 pestes animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una
10 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
15 ("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
20 combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") deben señalarse además, 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")
25 deben señalarse además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas,

- 36 -

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 algodón, variedades de soja y
5 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), Nucotr® (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 comercializan bajo las marcas
10 registradas Roundup Ready® (tolerancia contra Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinothricin, 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) pueden citarse también las variedades
15 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").

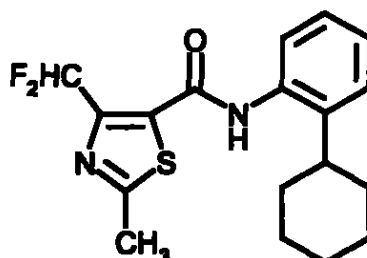
Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la
20 invención con los compuestos de la fórmula general (I) o bien de las mezclas de los productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las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

- 37 -

La obtención y el empleo de los productos activos según la invención se desprenden de los ejemplos siguientes.

Ejemplos de obtención.

Ejemplo 1.



5

Se añaden, gota a gota, a una suspensión de carbonato de potasio (138 mg) en acetonitrilo (30 ml) 2-ciclohexilanilina (175 mg, 1 mmol) y cloruro de 4-(difluorometil)-2-metil-1,3-tiazol-5-carbonilo (212 mg, 1.2 mmol). La mezcla de la reacción se agita durante 10 horas.

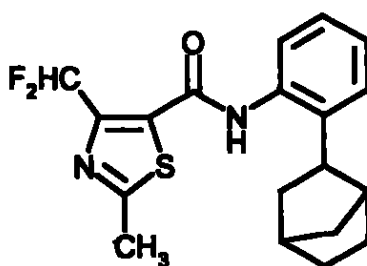
10

Para la elaboración se combina la mezcla de la reacción con agua (30 ml) y, a continuación, se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se seca con sulfato de magnesio, se filtra y se concentra por evaporación. El residuo se purifica sobre gel de sílice (gradiente ciclohexano/acetato de etilo 100:0 → 20:80).

15

Se obtienen 210 mg (57 %) de N-(2-ciclohexilfenil)-4-(difluorometil)-2-metil-1,3-tiazol-5-carboxamida con el logP (pH 2,3) = 3,50

Ejemplo 2



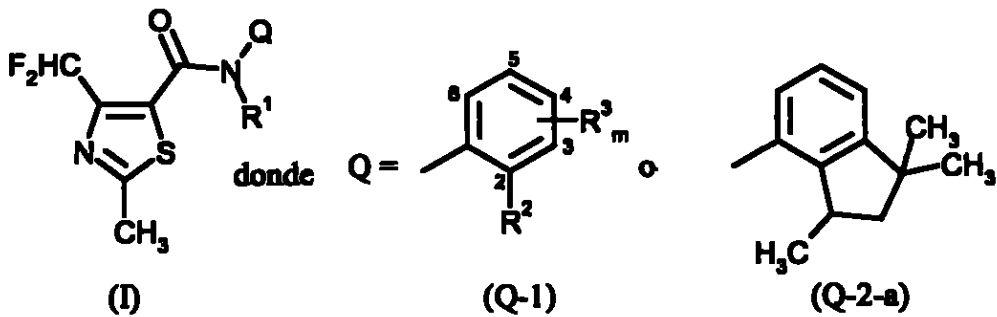
Se añade, gota a gota, a una suspensión de carbonato de potasio (415 mg) en acetonitrilo (30 ml) 2- biciclo[2.2.1]hept-2-ilanilina (562 mg, 3 mmoles) y cloruro de 4-(difluórmetil)-2-metil-1,3-tiazol-5-carbonilo (635 mg, 3,6 mmoles. la mezcla de la reacción se agita durante 10 horas.

5 Para la elaboración se combina la mezcla de la reacción con agua (30 ml) y, a continuación se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se seca con sulfato de magnesio, se filtra y se concentra por evaporación. El residuo se purifica sobre gel de sílice (gradiente ciclohexano/acetato de etilo 100:0 → 20:80).

Se obtienen 150 mg (13 %) de N-(2-biciclo[2.2.1]hept-2-ilfenil)-4-(difluórmetil)-
10 2-metil-1,3-tiazol-5-carboxamida con el logP (pH 2,3) = 3,63

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2, así como de acuerdo con las indicaciones dadas en la descripción general del procedimiento, se obtienen, también, los compuestos indicados en la tabla 1 siguiente.

Tabla 1



Ejem.	Q	R ¹	R ²	R ³ _m	logP (pH2.3)
3	Q-1	H	Biciclo[2,2,1]hept-2-ilo	4-CH ₃	3,92
4	Q-1	H	Biciclo[2,2,1]hept-2-ilo	5-CH ₃	4,00
5	Q-1	H	Cicloheptilo	4-F	3,84
6	Q-1	H	Ciclopentilo	4-F	3,24
7	Q-2-a	H	—	—	3,62
8	Q-1	H	Ciclooctilo	—	4,06

Ejem.	Q	R ¹	R ²	R ³ _m	logP (pH2.3)
9	Q-1	H	Ciclooctilo	4-CH ₃	4,43
10	Q-1	H	Ciclopentilo	4,5-(CH ₃) ₂	3,78
11	Q-1	H	Ciclooctilo	4-F	4,10
12	Q-1	H	Ciclooctilo	5-CH ₃	4,44
13	Q-1	H	Ciclooctilo	5-F	4,10
14	Q-1	H	Bicilco[2,2,1]hept-2-ilo	4-Br	4,27
15	Q-1	H	Bicilco[2,2,1]hept-2-ilo	4,5-(CH ₃) ₂	4,22
16	Q-1	H	Ciclopentilo	—	3,19
17	Q-1	H	4-Metilciclohexilo	—	3,82
18	Q-1	H	(3 <i>R</i>)-3-Metilciclohexilo	—	3,88
19	Q-1	CH ₃	Bicilco[2,2,1]hept-2-ilo	—	3,96
20	Q-1	CH ₃	Ciclohexilo	—	3,85
21	Q-1	COCH ₃	Bicilco[2,2,1]hept-2-ilo	—	3,95
22	Q-1	COCH ₃	Ciclohexilo	—	3,86
23	Q-1	H	2-Ciclohepten-1-ilo	4-F	3,68
24	Q-1	H	Cicloheptilo	—	3,81

La determinación de los valores logP, indicados en las tablas precedentes y en los ejemplos de obtención, se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

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

El calibrado se llevó a cabo con alcano-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores de 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 los espectros de UV con 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Ejemplos de aplicación:

5 Ejemplo A

Ensayo con *Sphaerotheca* (pepino) / protector

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.
 24,5 Partes en peso de N,N-dimetilacetamida.
Emulsionante: 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter

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

- 15 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras secado del recubrimiento aplicado por pulverización se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea*. Las plantas se disponen a continuación en el invernadero aproximadamente a 23°C y con una humedad relativa del aire del 70 %.

- 20 Al cabo de 7 días desde la inoculación se lleva a cabo la evaluación. En este caso 0 % significa una actividad que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se observa ataque.

Los productos activos, las cantidades aplicadas y los resultados de los ensayos se desprenden de la tabla siguiente.

Tabla A
Ensayo con *Sphaerotheca* (peplino) / protector

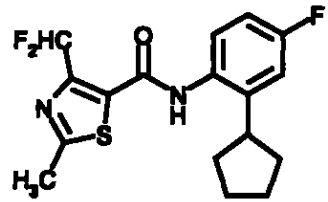
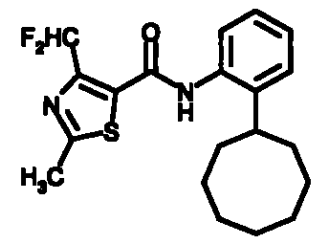
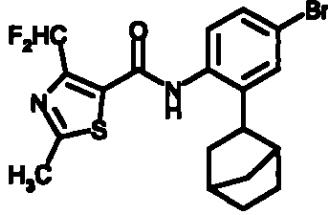
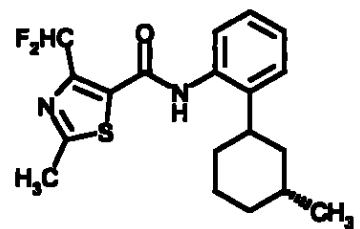
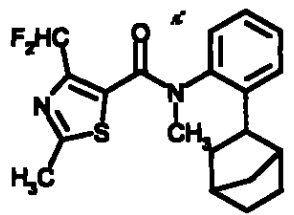
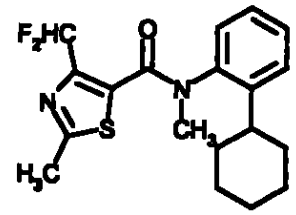
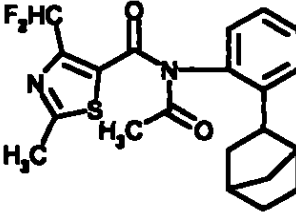
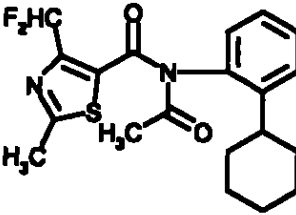
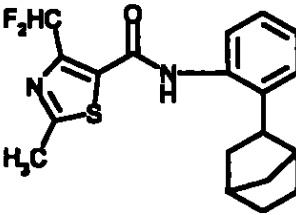
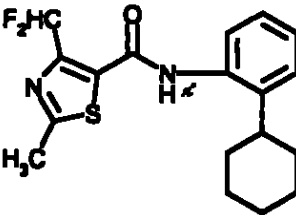
Producto activo	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
6 	100	88
8 	100	93
14 	100	100
18 	100	100
19 	100	98

Tabla A
Ensayo con *Sphaerotheca* (pepino) / protector

Producto activo		Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
20		100	100
21		100	98
22		100	96
2		100	100
1		100	89

Ejemplo B**Ensayo con *Venturia* (manzano) / protector****Disolvente:** 24,5 Partes en peso acetona.

24,5 Partes en peso dimetilacetamida.

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

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de 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 la cantidad de aplicación indicada. Tras secado del recubrimiento aplicado por pulverización se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de conidios de patógeno de la antracnosis del manzano *Venturia inaequalis* y permanecen a continuación durante 1 día aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

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

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

20 Los productos activos, las cantidades aplicadas y los resultados de los ensayos se desprenden de la tabla siguiente

Tabla B
Ensayo con Venturia (manzano) / protector

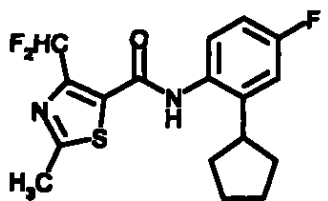
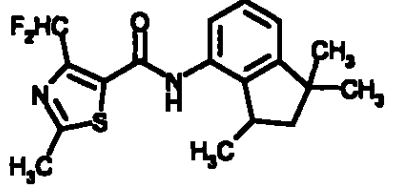
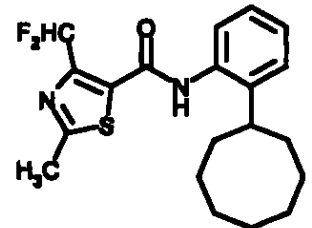
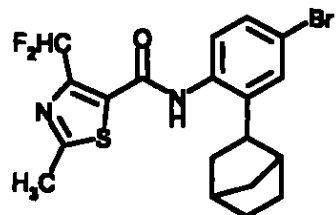
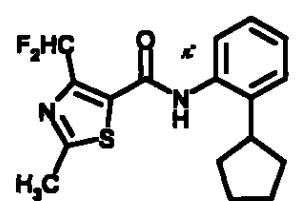
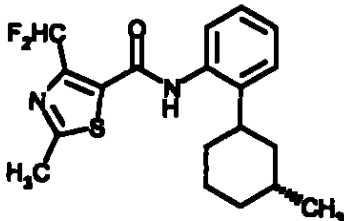
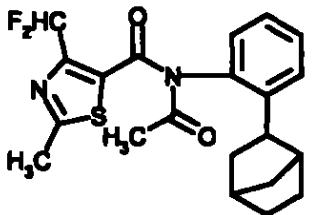
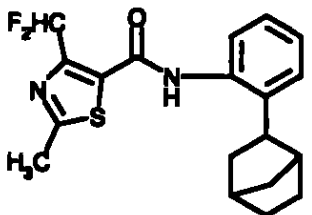
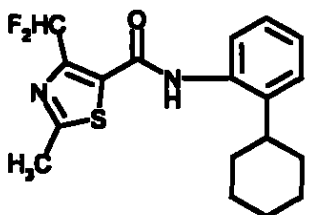
Producto activo		Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
6		100	99
7		100	100
8		100	100
14		100	100
16		100	99

Tabla B
Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Producto activo		Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
18		100	100
21		100	96
2		100	100
1		100	100

Ejemplo C**Ensayo con *Puccinia* (trigo)/protector**

Disolvente: 25 Partes en peso de N,N-dimetilacetamida.

Emulsionante: 0,6 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de productos activos 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.

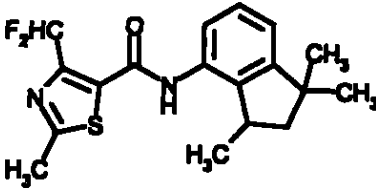
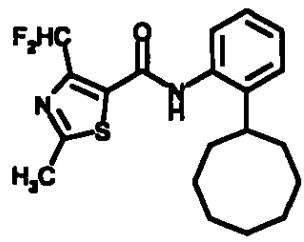
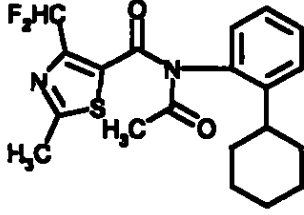
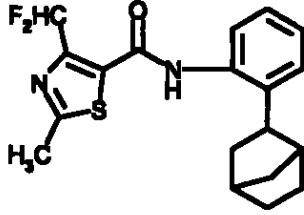
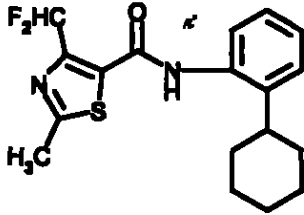
- 10 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento aplicado por pulverización se espolvorean las plantas con una suspensión de conidios de *Puccinia recondita*. Las plantas permanecen 48 horas a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

- 15 Las plantas se disponen en un invernadero a una temperatura de 20°C aproximadamente y con una humedad relativa del aire del 80 % aproximadamente para favorecer el desarrollo de las pústulas de la roya.

La evaluación se produce 10 días después de 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.

- 20 Los productos activos, las cantidades aplicadas y los resultados de los ensayos se desprenden de la tabla siguiente.

Tabla C
Ensayo con Puccinia (trigo) / protector

Producto activo		Cantidad aplicada en producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
7		500	100
8		500	100
22		500	93
2		500	100
1		500	100

Ejemplo D

- 48 -

Ensayo con *Alternaria* (tomate)/protector

Disolvente: 49 Partes en peso de N,N-dimetilacetamida.

Emulsionante: 1 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

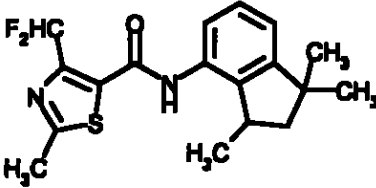
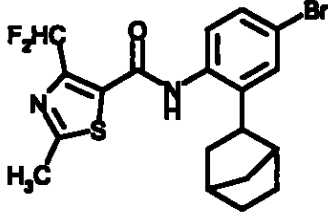
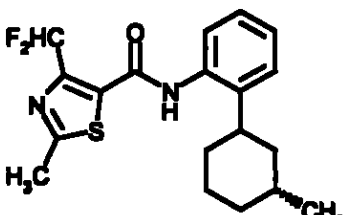
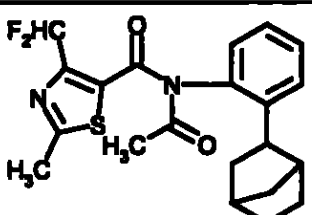
5 Para la obtención de una preparación conveniente del producto activo se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

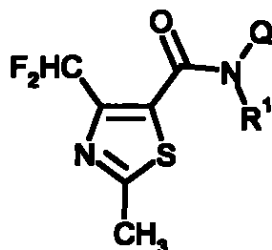
10 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Al cabo de 1 día, desde el tratamiento, se inoculan las plantas con una suspensión de esporas de *Alternaria solani*. Las plantas se dejan reposar, seguidamente, durante 24 horas con una humedad relativa del aire del 100 % y a 20°C. A continuación se disponen las plantas con una humedad relativa del aire del 96 % y a una temperatura de 20°C.

15 La evaluación se produce 7 días después de 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.

Los productos activos, las cantidades empleadas y los resultados de los ensayos se desprenden de la tabla siguiente

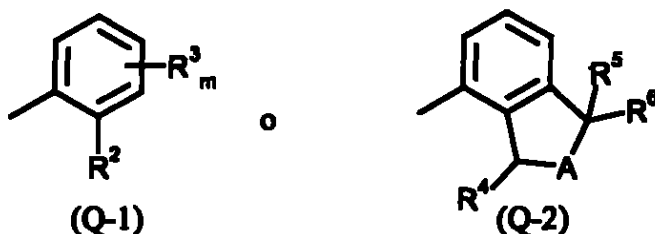
Tabla D
Ensayo con *Alternaria* (tomate) / protector

Producto activo		Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
7		750	100
14		750	95
18		750	100
21		750	100

REIVINDICACIONES**1.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I)**

en la que

5 Q significa un grupo



- R¹** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ o -CH₂NR¹⁰R¹¹,
- R²** significa, cicloalquilo con 3 a 12 átomos de carbono, cicloalquenilo con 3 a 12 átomos de carbono, bicicloalquilo con 6 a 12 átomos de carbono o bicicloalquenilo con 6 a 12 átomos de carbono, substituidos respectivamente en

- caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno, por ciano, por hidroxilo, por alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono con, respectivamente,
- 5 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R^3 significa flúor, cloro, bromo o metilo,
- m significa 0, 1, 2, 3 o 4,
- A significa O (oxígeno) o CR^{12} ,
- R^4, R^5, R^6 y R^{12} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo o etilo,
- 10 R^7 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 15 halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo o 4-(difluórmethyl)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo,
- R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con,
- 20 respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están
- 25 enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por

- 52 -

halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{13} ,

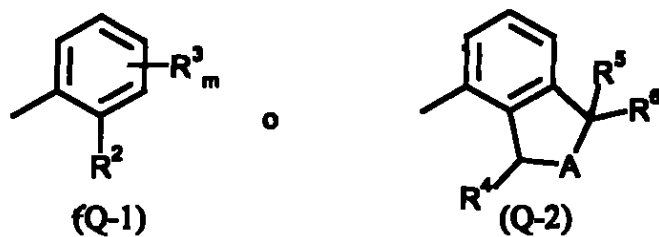
5 R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo

10 R^{10} y R^{11} forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{13} ,

R^{13} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

15 2.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, en la que

Q significa un grupo



20 R^1 significa hidrógeno; alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con

- 53 -

- 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁷,
 5 -CONR⁸R⁹ o -CH₂NR¹⁰R¹¹,
 R² significa, cicloalquilo con 3 a 12 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 12 átomos de carbono substituido, cicloalquenilo con 3 a 12 átomos de carbono, bicicloalquilo con 6 a 12 átomos de carbono o bicicloalquenilo con 6 a 12 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado de una hasta cuatro
 10 veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por hidroxilo, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
 15 R³ significa flúor, bromo o metilo,
 m significa 0, 1, 2 o 3,
 A significa O (oxígeno) o CR¹²,
 R⁴, R⁵ y R⁶ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo o etilo,
 R⁷ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos
 20 de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta
 25 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo o 4-(difluórometil)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo,

10

- 54 -

5 R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

10 R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo, substituido, en caso dado, desde una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{13} ,

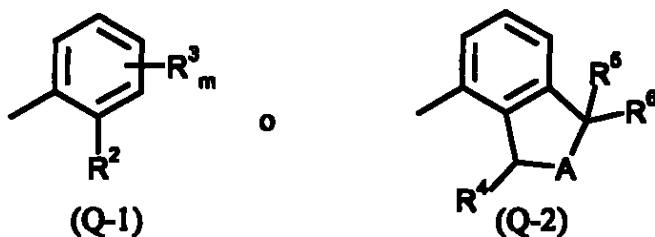
15 R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

20 R^{10} y R^{11} forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más no contiguos de la serie formada por oxígeno, por azufre o por NR^{12} ,

R^{13} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

25 3.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, en la que

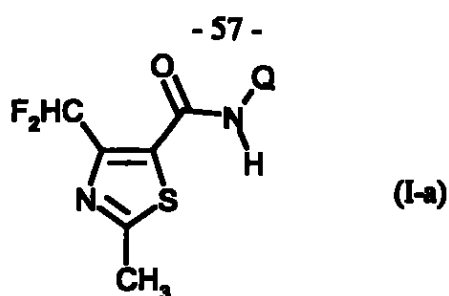
Q significa un grupo



- R¹** significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluórmétilo, triclorometilo, trifluóretilo, difluórmétilsulfanilo, difluórclorometilsulfanilo, trifluórmétilsulfanilo, trifluórmétilsulfinilo, trifluórmétilsulfonilo, trifluórmétoximetilo; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ o -CH₂NR¹⁰R¹¹,
- 10 R²** significa, cicloalquilo con 3 a 10 átomos de carbono, cicloalquenilo con 3 a 10 átomos de carbono, bicicloalquilo con 6 a 10 átomos de carbono o bicicloalquenilo con 6 a 10 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado de una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por hidroxilo, por metilo, por etilo, por n- o iso-propilo, por n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o iso-propoxi, por n-, iso-, sec.- o terc.-butoxi, por trifluórmétilo, por difluórmétilo, por triclorometilo, por difluórclorometilo, por trifluórmétoxi, por difluórmétoxi, por triclorometoxi, por difluórclorometoxi,
- 15 R³** significa flúor, bromo o metilo,
- 20 m** significa 0, 1, 2 o 3,
- A** significa O (oxígeno) o CR¹²,
- R⁴** significa metilo o etilo,
- R⁵ y R⁶** significan metilo,

- 56 -

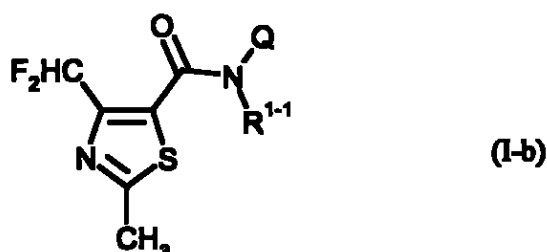
- R⁷** significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, terc.-butoxi, ciclopropilo; trifluórmétilo, trifluórmetoxi o 4-(difluórmétil)-2-metil-1,3-tiazol-2-ilo,
- R⁸ y R⁹** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluórmétilo, triclorometilo, trifluóretilo, trifluórmetoximetilo,
- R⁸ y R⁹** forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina substituidos respectivamente, en caso dado, de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, pudiendo estar substituida la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógeno por R¹³,
- R¹⁰ y R¹¹** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluórmétilo, triclorometilo, trifluóretilo, trifluórmetoximetilo,
- R¹⁰ y R¹¹** forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, substituidos respectivamente, en caso dado de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, pudiendo estar substituida la piperazina en el segundo átomos de nitrógeno por R¹³,
- R¹²** significa hidrógeno o metilo,
- R¹³** significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo.
- 4.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-a)



en la que

Q tiene el significado indicado en la reivindicación 1.

5.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-b)



5

en la que

Q tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

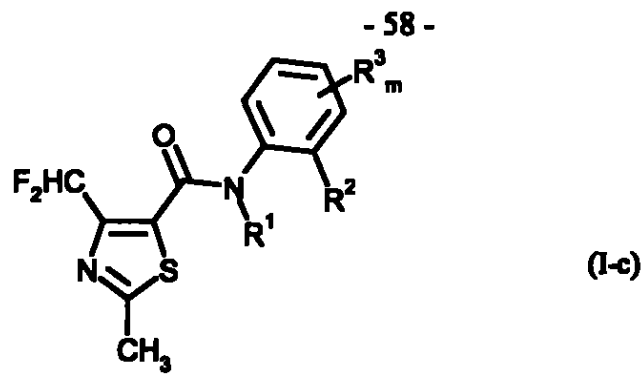
R¹⁻¹ significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁷, -CONR⁸R⁹ o -CH₂NR¹⁰R¹¹,

10

15

R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹ tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

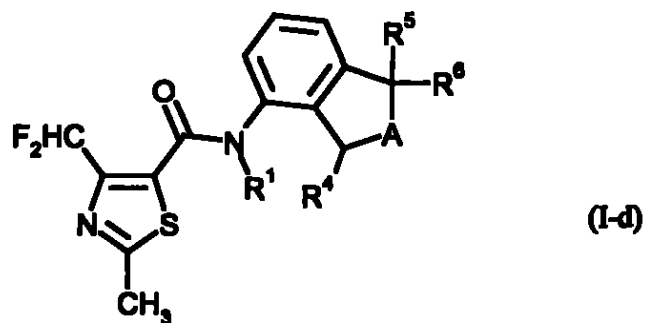
6.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-c)



en la que

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

7.- Tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I-d)



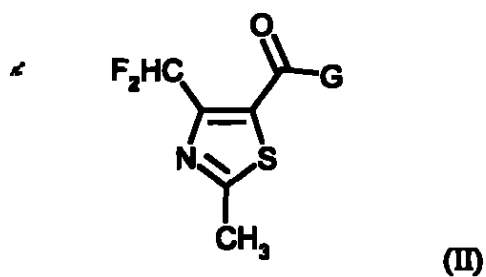
5

en la que

A, R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

8.- Procedimiento para la obtención de tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizado porque

10 A) se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílico de la fórmula (II)



en la que

G significa halógeno, hidroxilo o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,

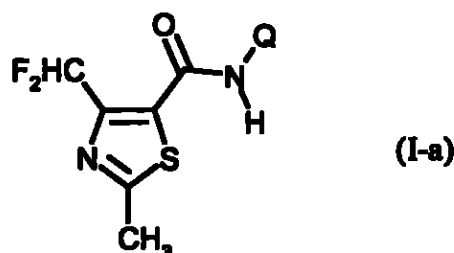
en una primera etapa con derivados de anilina de la fórmula (III)



en la que

Q tiene los significados indicados en la reivindicación 1,

5 en presencia de un agente aceptor de ácido y en presencia de un diluyente y los productos, obtenidos de este modo, de la fórmula (I-a)



en la que

Q tiene los significados indicados en la reivindicación 1,

10 se hacen reaccionar, en caso dado, en una segunda etapa con un halogenuro de la fórmula (IV)



en la que

15 R^{1-1} significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 20 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,

116

- 60 -

R^7, R^8, R^9, R^{10} y R^{11} tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y

X significa cloro, bromo o yodo,

en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

5 9.- Agente para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado por que tiene un contenido en al menos una tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilida de la fórmula (I) según la reivindicación 1 además de extendedores y/o productos tensioactivos.

10.- Empleo de tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1 para la lucha contra los microorganismos indeseados.

10 11.- Procedimiento para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado porque se aplican sobre los microorganismos y/o sobre su medio ambiente tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1.

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

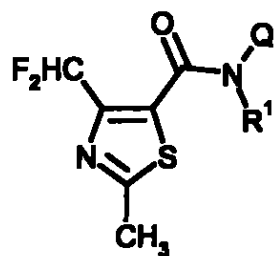
15

Handwritten signature

- 61 -

RESUMEN

Nuevas tiazol-(bi)cicloalquil-carboxanilidas de la fórmula (I)



en la que

- 5 Q y R¹ tienen los significados indicados en la descripción,
un procedimiento para la obtención de estos productos y su empleo para la lucha contra
los microorganismos indeseados.

κ

Expediente No		05049751	No de Folia
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	x	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:

sobre contarse Ate final

119

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 05045751 00000000 Folios: 119
Fecha (MSD): 2005-05-26 17:29:20
Trámite : 011 PCI-PATENTE 379 PAG. NÚM. 411 Incubadora
Dependencia: 2000 División de MEYMS UNASUUNCA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 35,926
FECHA : MAYO 16 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	40116714	16/05/2005	39,471.000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	443,000.00
		TOTAL :	443,000.00

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

0010 13549-841-029-3

120

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.	()	()
- 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:



Fecha:

SECRETARIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

AMICACION : COMIS/31 000000

FOLIOS: 115

FECHA UNID: 2020-05-20 11:53:10

Trámite : VII PL-PRIMA: 373 RBA: MAL 411 PRACERIA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor:
EMILIO FERRERO
Apoderado
BAYER CROPSCIENCE AG

Oficio N° 06229

ASUNTO:	Radicación N°	05-49751
	Solicitud internacional	PCT/EP2003/011392
	Fecha inicio fase nacional	31/05/2005
	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 copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486).

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

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



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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha, 29 JUL 2005.

202030

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Commutador: 534 12 21-23-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@aic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

HR

29 Jul 05