

UX - 1



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

08-34060

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO "DEBUDOM" PLAGUICIDAS DE BIFENILAMIDA

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER CROPS SCIENCE A.G

DOMICILIO ALEMANIA

74. APODERADO ALVARO CORREA OROZUEZ
T.P. 20.281

22. BOGOTÁ, D. C., ABRIL, 2008

PETITORIO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-034060-00000-0000

Fecha: 2008-04-04 16:27:57 Dep: 2020 NUECREACION
Inv: 11 PATENTE/ITL Evt: 378 FASENACIONAL
Act: 411 PRESENTACION Folios: 108

ción

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE

PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

13 Abril 2008

①

SOLICITUD DE :

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

②

SOLICITANTE

(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG

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

Nacionalidad o Domicilio: Alemania

Lugar de Constitución: Alemania

Teléfono:

Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No.10-62 Piso 6

Teléfono: 634 1500

Fax: 376 2211

E-Mail: office.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

79.143.366 de
Usaquén

TP 20.281

④

INVENTOR (ES)

(72)

Nombre: KUNZ, Klaus; GREUL, Jörg; GUTH, Oliver; HARTMANN, Benoit; ILG, Kerstin; MORADI, Wahed; SEITZ, Thomas; DAHMEN, Peter; VOERSTE, Amd; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike; DREWES, Mark; DUNKEL, Ralf; EBBERT, Ronald; GAYER, Herbert; HILLEBRAND, Stefan; FRANKEN, Eva-Maria; MAISAM, Olga y EBBINGHAUS-KINTSCHER, Ulrich

Dirección: Hochdabler Strasse 3, 40625 Düsseldorf, Alemania; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen, Alemania; 72C, 51371 Leverkusen, Alemania; 12 chemin Antoinette, F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon, Francia; Isidor-Caro-Strasse 52, 51061 Köln, Alemania; Maria-Merian Strasse 7, 40789 Monheim an Rhein, Alemania; Rietherbach 10b, 40764 Langenfeld, Alemania; Altebrückerstrasse 63, 41470 Neuss, Alemania; Mozartstrasse 3-5, 50674 Köln, Alemania; Oberer Markweg 85, 56566 Neuwied, Alemania; Goethestrasse 38, 40764 Langenfeld, Alemania; 11 Rue Pierre Dupont, F-69001 Lyon, Francia; Leskowstrasse 60, 90475 Nürnberg, Alemania; Sandstrabe 66, 40789 Monheim Am Rhein, Alemania; Lothringer Strasse 22, 41462 Neuss, Alemania; Sternstrasse 21, 42799 Leichlingen, Alemania; Vor Dem Klosterhof 19, 51503 Rösrath, Alemania y Wittrauckerstrasse 122, 44287 Dortmund, Alemania

Nacionalidad o Domicilio: Alemán, Alemán, Alemán, Francés, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán y Alemán, respectivamente

⑤ PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2006/066271

Fecha 12-SEP-06

Publicación Internacional No. WO/2007/031512

Fecha 22-MAR-07

⑥ Título (54)

DERIVADOS PLAGUICIDAS DE BIFENILAMIDA

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07C 257/12, A01N 37/52, A01N 43/40, C07D 295/195

⑧

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI

☒

NO

☐

EP

13-SEP-05

05356153.6

⑨

Comprobante de pago No. 08-23074

Fecha 17-MAR-08

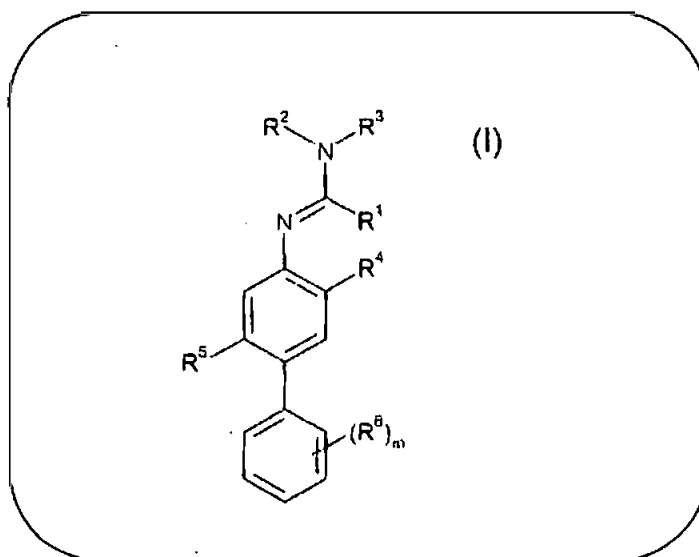
10

ANEXOS

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

11

FIGURA CARATERISTICA



12

Solicito la concesión de la patente

NOMBRE ALVARO CORREA ORDÓÑEZ

FIRMA

C.C. 279.143.366 de Usaquén

T.P. 20.261

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

2008 / 006

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 00 - 23,674
FECHA : MARZO 17 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-034060- -00000-0000

Fecha: 2008-04-04 16:27:57 Dep. 2020 NUECREACION
Tia. 11 PATENTE/II Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 108

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754367	116634	14/03/2008	52,393,300.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
1		TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
		TOTAL :	501,000.00

SOL: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

(43) International Publication Date
22 March 2007 (22.03.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/031512 A2

(51) International Patent Classification:

C07C 257/12 (2006.01) A01N 37/52 (2006.01)

C07D 295/195 (2006.01) A01N 43/40 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/EP2006/066271

(22) International Filing Date:

12 September 2006 (12.09.2006)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

05356153.6 13 September 2005 (13.09.2005) EP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim Am Rhein (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): KUNZ, Klaus [DE/DE]; Hochdahl Strasse 3, 40625 Düsseldorf (DE). GREUL, Jörg [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen (DE). GUTH, Oliver [DE/DE]; Lohrstrasse 72C, 51371 Leverkusen (DE). HARTMANN, Benoit [FR/DE]; Färberstrasse 1, 40764 Langenfeld (DE). ILG, Kerstin [DE/DE]; Isidor-Caro-Strasse 52, 51061 Köln (DE). MORADI, Wahed [DE/DE]; Gerstenkamp 12, 51061 Köln (DE). SEITZ, Thomas [DE/DE]; Rietherbach 10b, 40764 Langenfeld (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrückerstrasse 63, 41470 Neuss (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Mozartstrasse 3-5, 50674 Köln (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markweg 85, 56566 Neuwied (DE). DREWES, Mark [DE/DE]; Goethestrasse 38, 40764 Langenfeld (DE). DUNKEL, Ralf [DE/FR]; 11 Rue Pierre Dupont, F-69001 Lyon (FR). EBBERT, Ronald [DE/DE]; Nikolaus-Kopernikus-Strasse 13, 40789 Monheim (DE).

GAYER, Herbert [AT/DE]; Sandstrabe 66, 40789 Monheim Am Rhein (DE). HILLEBRAND, Stefan [DE/DE]; Lothringer Strasse 22, 41462 Neuss (DE). FRANKEN, Eva-Maria [DE/DE]; Sternstrasse 21, 42799 Leichlingen (DE). MAI-SAM, Olga [DE/DE]; Vor Dem Klosterhof 19, 51503 Rürsath (DE). EBBINGHAUS-KINTSCHER, Ulrich [DE/DE]; Wittbrauckerstrasse 122, 44287 Dortmund (DE).

(74) Agent: BALMEFREZOL, Ludovic; Bayer Cropscience SA, Patents & Licensing Department, 14-20 Rue Pierre Baizet, F-69009 Lyon (FR).

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

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Declarations under Rule 4.17:

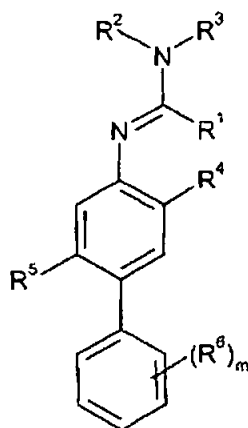
- as to applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii))
- of inventorship (Rule 4.17(iv))

Published:

- without international search report and to be republished upon receipt of that report

[Continued on next page]

(54) Title: PESTICIDE BI-PHENYL-AMIDINE DERIVATIVES



(I)

(57) Abstract: The present invention relates to bi-phenyl-amidine derivatives of formula (I) in which the substituents are as in the description, their process of preparation, their use as fungicide or insecticide active agents, particularly in the form of fungicide or insecticide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi or damaging insects, notably of plants, using these compounds or compositions:



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

PESTICIDE BI-PHENYL-AMIDINE DERIVATIVES

DESCRIPTION

The present invention relates to bi-phenyl-amidine derivatives, their process of preparation, their process of preparation, their use as fungicide or insecticide active agents, particularly in the form of fungicide or insecticide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi or damaging insects, notably of plants, using these compounds or compositions.

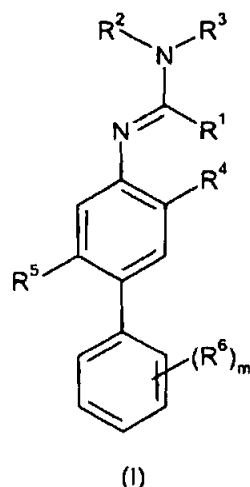
In international patent application WO-00/46184 certain phenyl-amidine derivatives are disclosed. However, this document does not specifically disclose nor suggest to select such compounds wherein the phenyl ring is substituted according to the invention thus allowing an unexpected and significantly higher fungicide activity.

It is always of high-interest in agriculture to use novel pesticide compounds in order to avoid or to control the development of resistant strains to the active ingredients. It is also of high-interest to use novel compounds being more active than those already known, with the aim of decreasing the amounts of active compound to be used, whilst at the same time maintaining an effectiveness at least equivalent to the already known compounds.

In the same way, it is also always of high-interest to use novel insecticide, nematocide or acaricide agents to control damaging insects or other damaging organisms.

We have now found a new family of compounds which possess the above mentioned effects or advantages.

Accordingly, the present invention provides bi-phenyl-amidine derivatives of formula (I) :



wherein

- R^1 represents H, a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkenyl, a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkynyl, SH or a substituted or non substituted S- C_1 - C_{12} -alkyl ;
- 5 • R^2 represents a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl ;
- R^3 represents a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted C_3 - C_8 -cycloalkyl, substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkenyl, substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkynyl, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl ; or
- 10 • R^1 and R^2 , R^1 and R^3 or R^2 and R^3 can form together a substituted or non substituted 5 to 7-membered heterocycle ;
- R^4 represents a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a halogen atom, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted O- C_1 - C_{12} -alkyl or cyano ;
- m represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5 ;
- 15 • R^5 represents H, a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a halogen atom, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted O- C_1 - C_{12} -alkyl or cyano ;
- R^6 , which may be the same or different, represents H, a halogen atom, nitro, cyano ; trialkylsilyl, C_1 - C_8 -alkyl, substituted or non-substituted C_1 - C_4 -alkyl-phenyl, substituted or non-substituted phenyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_8 -alkylthio, C_1 - C_8 -halogenoalkyl, C_1 - C_8 -halogenalkoxy or C_1 - C_8 -halogenoalkylthio, substituted or non
- 20 substituted C_1 - C_4 -alkoxy-phenyl like benzyloxy, substituted or non substituted phenoxy, substituted, non substituted alkylamino- C_1 - C_8 - NR^7R^8 , substituted, non substituted NR^7R^8 , C_1 - C_8 -alkyl-S(O) $_nR^9$, -S(O) $_nR^9$, C_1 - C_8 -alkyl-SO $_2NR^7R^8$, -SO $_2NR^7R^8$, C_1 - C_8 -alkyl-C(O) R^{10} , -CR 9 =N-O- R^{11} ;
- two substituents R^6 may form a carbocyclic or heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ;
- 25 • n represents 0, 1 or 2 ;
- R^7 and R^8 , which may be the same or different, represent H, substituted or non-substituted C_1 - C_6 -alkyl ;
- R^7 and R^8 may form a heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ;
- 30 • R^9 represents H, substituted or non-substituted, linear or branched C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -alkenyl, C_1 - C_8 -alkynyl ;
- R^{10} represents H, substituted or non-substituted, linear or branched C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -alkoxy, NR^7R^8 ;
- 35 • R^{11} represents H, substituted or non-substituted, linear or branched C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_4 -alkyl-phenyl, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, substituted or non-substituted C_1 - C_4 -alkyl-phenyl, substituted or non-substituted phenyl ;

- R^9 and R^{11} may form a heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ;

as well as salts, N-oxydes, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof.

5

Any of the compounds according to the invention can exist in one or more optical, geometric or chiral isomer forms depending on the number of asymmetric centres in the compound. The invention thus relates equally to all the optical isomers and to their racemic or scalemic mixtures (the term "scalemic" denotes a mixture of enantiomers in different proportions), and to the mixtures of all the possible stereoisomers, in all proportions. The diastereoisomers and/or the optical isomers can be separated according to the methods which are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

10

Any of the compounds according to the invention can also exist in one or more geometric isomer forms depending on the number of double bonds in the compound. The invention thus relates equally to all geometric isomers and to all possible mixtures, in all proportions. The geometric isomers can be separated according to general methods, which are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

15

For the compounds according to the invention, halogen means either one of fluorine, bromine, chlorine or iodine and heteroatom can be nitrogen, oxygen or sulphur.

20

Preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^1 represents H ; C_1 - C_{12} -alkyl, preferably C_1 - C_{12} -alkyl like methyl ; or SH.

25

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^2 represents methyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^3 represents C_2 - C_{12} -alkyl, preferably a non substituted C_2 - C_4 -alkyl like ethyl, n-propyl, i-propyl ; C_2 - C_{12} -alkenyl, preferably C_3 - C_4 -alkenyl like propenyl or allyl ; C_3 - C_6 -cycloalkyl like cyclopropyl.

30

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^2 and R^3 can form together a substituted or non substituted 5 to 7-membered heterocycle, preferably a 6-membered heterocycle, more preferably a piperidinyl or a pyrrolidinyl, even more preferably a 2-alkylated-pyrrolidinyl like a 2-methyl-pyrrolidinyl.

35

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^4 represents a C_1 - C_{12} -alkyl, preferably a non substituted C_1 - C_{12} -alkyl like methyl and ethyl ; a halogen atom like a fluorine and a chlorine atom ; trifluoromethyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R⁵ represents a H, C₁-C₁₂-alkyl, preferably a non substituted C₁-C₁₂-alkyl like methyl and ethyl ; a halogen atom like a fluorine and a chlorine atom ; trifluoromethyl.

- 5 Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein m represents 1, 2, 3 or 4 ; even more preferably m represents 1, 2 or 3.

- Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R⁶, which may be the same or different, represents H ; F, Cl, Br, I ; nitro ; cyano ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₄-alkyl-phenyl which may be non substituted or substituted by halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl ; phenyl which may be non substituted or substituted by halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl ; C₁-C₆-alkoxy ; C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl ; C₁-C₆-alkylthio ; C₁-C₆-halogenoalkyl ; C₁-C₆-halogenalkoxy ; C₁-C₆-halogenoalkylthio ; C₁-C₆-alkoxy ; C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl ; C₁-C₆-alkylthio ; benzyloxy which may be non substituted or substituted by halogen ;
10 C₁-C₄-alkyl-NR⁷R⁸ ; S(O)_nR⁹ ; C₁-C₄-alkyl-S(O)_nR⁹ ; OR¹⁰ ; C₁-C₄-alkyl-COR¹⁰ ; -CR⁹=N-O-R¹¹.
15

- Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R⁷ and R⁸ which may be the same or different, represent H, C₁-C₆ alkyl or R⁷ and R⁸ may form a heterocyclic ring comprising further heteroatoms selected in the list consisting of O, S, N.
20

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R⁹ represents H, methyl or ethyl.

- 25 Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R¹⁰ represents H ; C₁-C₄-alkyl ; C₁-C₄-alkoxy ; NR⁷R⁸.

- Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R¹¹ represents H ; C₁-C₄-alkyl ; C₁-C₄-halogenoalkyl ; C₁-C₄-alkyl-phenyl wherein phenyl may substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl or C₁-C₄-halogenoalkoxy ; C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl ; phenoxy ; benzyloxy.
30

- Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R⁹ and R¹¹ may form a 5- or 6-membered heterocyclic ring comprising a further heteroatoms selected in the list consisting of O, S, N.
35

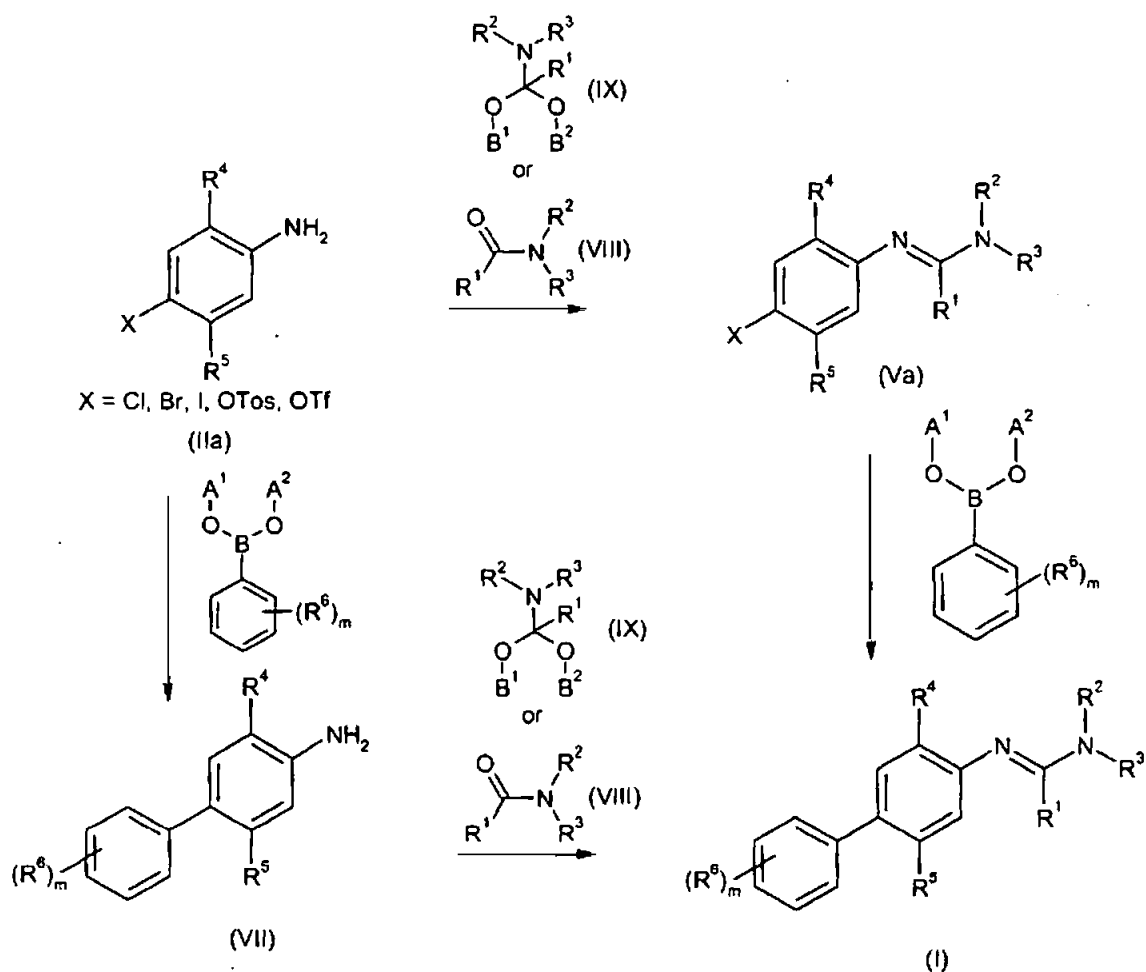
The above mentioned preferences with regard to the substituents of the compounds according to the invention can be combined in various manners. These combinations of preferred features

thus provide sub-classes of compounds according to the invention. Examples of such sub-classes of preferred compounds according to the invention can combine:

- preferred features of R^1 with preferred features of R^2 to R^6 or to R^{11} where applicable ;
- preferred features of R^2 with preferred features of R^1 to R^6 or to R^{11} where applicable ;
- preferred features of R^3 with preferred features of R^1 to R^6 or to R^{11} where applicable ;
- preferred features of R^4 with preferred features of R^1 to R^6 or to R^{11} where applicable ;
- preferred features of R^5 with preferred features of R^1 to R^6 or to R^{11} where applicable.

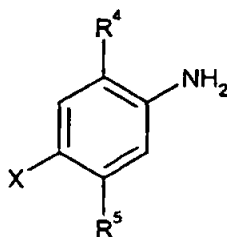
In these combinations of preferred features of the substituents of the compounds according to the invention, the said preferred features can also be selected among the more preferred features of each of m , n and R^1 to R^{11} so as to form most preferred subclasses of compounds according to the invention.

The present invention also relates to a process for the preparation of a compound of formula (I). Generally, the preparation of compound of formula (I) according to the invention can be carried out as illustrated by scheme 1.

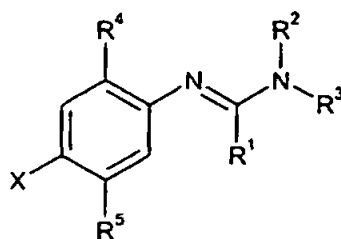


Scheme 1

Thus according to a further aspect according to the invention, there is provided a process (a) for the preparation of aniline derivatives of formulae (I) or (VII) by reacting aniline derivatives of formulae (IIa) or (Va)



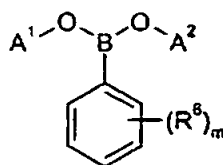
(IIa)



(Va)

wherein

- 10
- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as herein-defined and
 - X represents halogen, tosylate, SOMe, mesylate or triflate ;
- with a boronic acid derivative of formula (IV)



(IV)

wherein

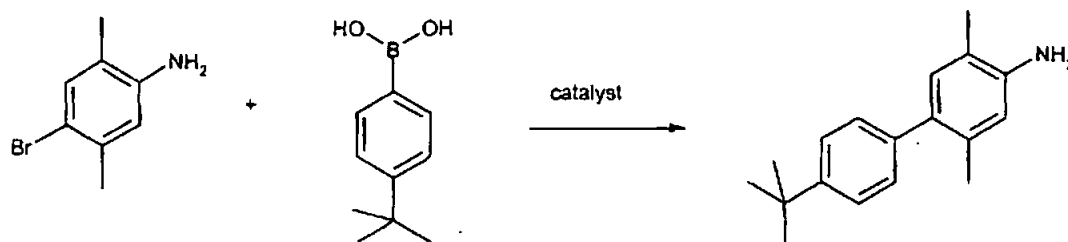
- 15
- m and R^6 are as herein-defined ;
 - A^1 and A^2 are each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene.

Process (a) according to the invention can further comprise one or more of the following

20 characteristics:

- presence of an acid binder;
- presence of an inert organic diluent;
- presence of a catalyst.

Process (a) according to the invention is carried out using 2,3-dimethyl-4-bromo-aniline and 4-tert-butyl-phenyl-boronic acid as starting materials and a catalyst. Process (a) can be conducted according to scheme 2 :



Scheme 2

For carrying out process (a) according to the invention, aniline or amidine derivatives of formulae (IIa) or (Va) respectively are used as starting materials.

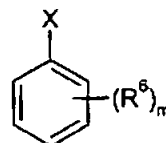
Preferred starting materials for process (a) according to the invention are compounds of formulae (IIa) or (Va) wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 represent substituents as herein-defined for preferred compound of formula (I) according to the invention.

X represents halogen, triflate, SOMe, mesylate, tosylate.

Aniline derivatives of formula (IIa) and boronic acid derivatives of formula (IV), as well as respective process for their preparation are known.

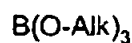
Formula (IV) provides a general definition of the boronic acid derivatives furthermore required as starting materials for carrying out process (a) according to the invention. In formula (IV), R^6 and m represent preferably substituents which have already been described as preferred in connection with compound of formula (I). A^1 and A^2 preferably each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene for compound of formula (IV).

Boronic acid derivatives of formula (IV) are known and can be prepared by known processes, for example described in WO-01/90084 or US-5,633,218. These derivatives can be obtained, for example, by reacting a phenyl derivative of formula (VI)



(VI)

wherein R^6 , and m are as herein-defined, X represents halogen, triflate, SOMe, mesylate, tosylate; with boric acid esters of formula (XI)

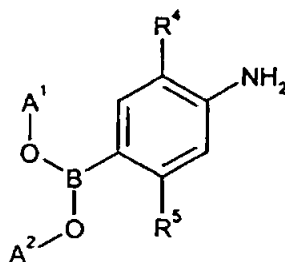


(XI)

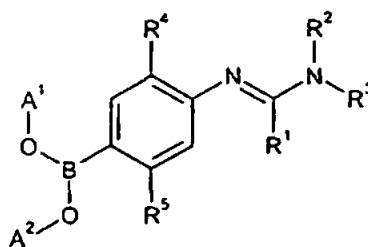
wherein Alk represents C₁-C₄-alkyl; or with 4,4,4',4',5,5,5',5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane ; in the presence of magnesium or alkyllithium. A diluent like tetrahydrofuran can be used.

Formula (XI) provides a general definition of the boric acid esters that can be used for preparing boronic acid derivatives of formula (IV) according to the invention. In formula (XI), Alk preferably represents methyl, ethyl, n- or iso-propyl, more preferably methyl or ethyl. Boric acid esters of formula (XI) are known compounds.

A further aspect according to the invention lies in a process (b) for the preparation of aniline derivatives of formulae (I) or (VII) by reacting boronic acid derivatives of formulae (IIb) or (Vb)



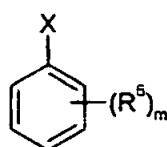
(IIb)



(Vb)

wherein

- R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as herein-defined and
 - A¹ and A² each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene;
- with phenyl derivatives of formula (VI)



(VI)

wherein

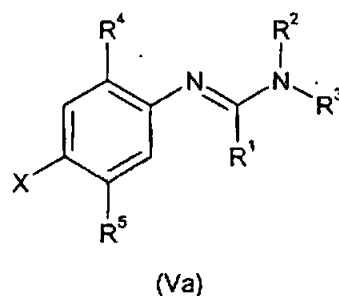
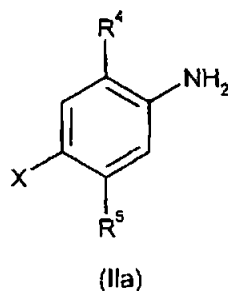
- R^6 and m are as herein-defined ;
- X represents halogen, triflate, SOMe, mesylate, tosylate.

Process (b) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:

5

- presence of an acid binder;
- presence of an inert organic diluent;
- presence of a catalyst.

10 A further aspect according to the invention lies in a process (c) for the preparation of aniline derivatives of formulae (I) or (VII) by reacting aniline derivatives of formulae (IIa) or (Va)

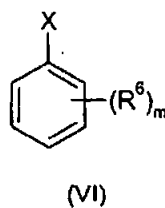


15

wherein

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as herein-defined and
- X represents halogen, triflate, SOMe, mesylate, tosylate ;

with phenyl derivatives of the formula (VI)



20

wherein

- R^6 and m are as herein-defined ;

- X represents halogen, triflate, SOMe, mesylate, tosylate ;

in the presence of a palladium, nickel or platinum catalyst and in the presence of 4,4',4'',5,5',5''-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane.

- 5 Process (c) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:

- presence of an acid binder;
- presence of an inert organic diluent.

- 10 Formula (IIa) and (Va) provide general definitions of the substituted amine derivatives useful as reaction components for carrying out processes (a) or (c) according to the invention. In these formulae, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ preferably represent substituents as herein-defined in connection with the description of compounds of formula (I) according to the invention. Halogen preferably represents chlorine, bromine or iodine, more preferably bromine or iodine.

- 15 Aniline derivatives of formula (II) are known compounds and can be prepared by known methods from the corresponding nitro compounds by reduction, or by halogenation of the corresponding aniline derivatives.

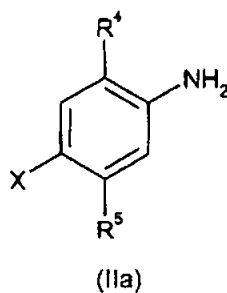
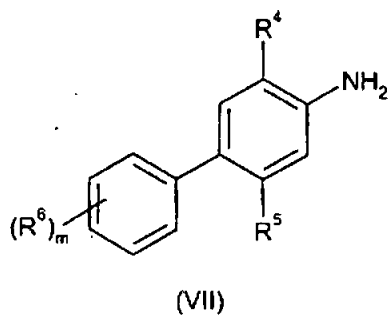
- 20 The boronic acid derivatives of formula (IV) that can be used as starting materials for carrying out process (a) according to the invention are known or commercially available reagents.

- Formulae (IIb) and (Vb) provide general definitions of the boronic acid derivatives useful as reaction components for carrying out process (b) according to the invention. In these formulae 25 R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ preferably represent substituents as herein-defined in connection with the description of compounds of formula (I) according to the invention. A¹ and A² preferably each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene.

- Boronic acid derivatives of formula (IIb), (Vb) or phenyl derivatives of formula (VI) are known 30 and can be prepared by known methods.

- Amidine derivatives of formulae (I) and (Va) can be obtained by a further process according to the invention. Various alternatives of process (d) according to the invention can be considered, they are defined as process (d1), process (d2) and process (d3) according to the invention.

- 35 Process (d) according to the invention comprises reacting aniline derivatives of formulae (VII) or (IIa) with different reagents thus defining processes (d1), (d2) and (d3) respectively

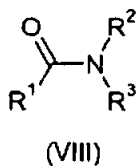


5

wherein

- R^4 , R^5 , R^6 and m are as herein-defined ;
- X represents halogen, triflate, S_{OMe}, mesylate or tosylate.

10 Process (d1) is carried out further using amide derivatives of formula (VIII)



wherein

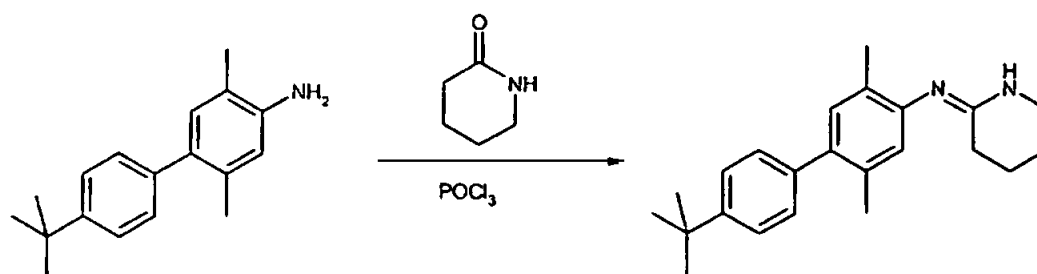
- 15
- R^1 , R^2 , R^3 are as herein-defined.

Process (d1) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:

- presence of a halogenation agent, like PCl_5 , PCl_3 , POCl_3 , SOCl_2 ;
- presence of a diluent.

20

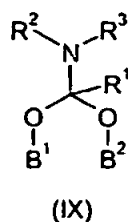
Process (d1) according to the invention is carried out using 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine, piperidin-2-one and phosphoric trichloride as starting materials and an acid. Process (d1) can be conducted according to scheme 3.



Scheme 3

Formula (VII) provides a general definition of the biphenylamines useful as starting materials for carrying out the process (d1) according to the invention. In this formula R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ and m preferably represent substituents or values as herein-defined in connection with the description of compounds of formula (I) according to the invention.

Process (d2) is carried out further using amino-acetal derivatives of formula (IX)



(IX)

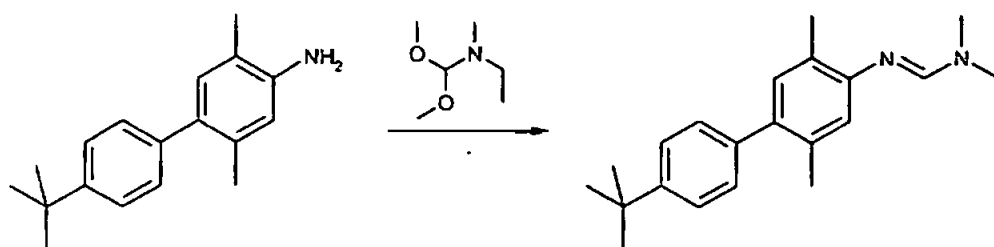
wherein

- R¹, R², R³ are as herein-defined ;
- B¹ and B² represent each alkyl or together cycloalkyl.

Process (d2) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:

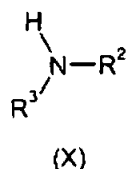
- presence of an acid or base ;
- presence of a diluent.

Process (d2) according to the invention is carried out using 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine and N-(dimethoxymethyl)-N-methylethanamine as starting materials. Process (d2) can be conducted according to scheme 4.



Scheme 4

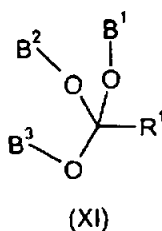
Process (d3) is carried out further using amine derivatives of formula (X)



wherein

- R^2 and R^3 are as herein-defined ;

in presence of orthoester derivatives of formula (XI)

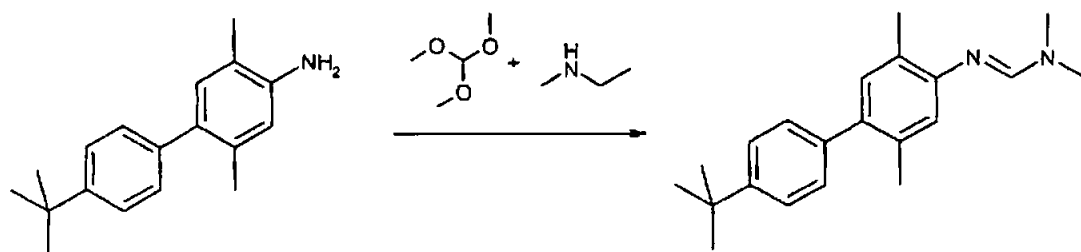


wherein

- R^1 is as herein-defined ;
- B^1 , B^2 and B^3 represent each alkyl.

Formula (VII) provides a general definition of the biphenylamines useful as starting materials for carrying out process (d3) according to the invention. In this formula R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 and m preferably represent substituents or values as herein-defined in connection with the description of compounds of formula (I) according to the invention.

Process (d3) according to the invention is carried out using 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine, trimethyl-ortho-ester and N-methyl-ethanamine as starting materials and an acid. Process (d3) can be conducted according to scheme 5.



Scheme 5

Formula (VII) provides a general definition of the biphenylamines useful as starting materials for carrying out the process (d3) according to the invention. In this formula R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6

and m preferably represent substituents or values as herein-defined in connection with the description of compounds of formula (I) according to the invention.

Processes (d), (d1), (d2) or (d3) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:

- presence of an acid or base ;
- presence of a diluent.

Suitable diluents for carrying out the processes (a), (b) and (c) according to the invention are all customary inert organic solvents. Preference is given to using aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; halogenated hydrocarbons, such as chlorobenzene, dichlorobenzene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, dichloroethane or trichloroethane; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl tert-butyl ether, methyl tert-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or iso-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; mixtures thereof with water or pure water.

Suitable diluents for carrying out the processes (d1), (d2) and (d3) according to the invention are in each case all customary inert organic solvents. Preference is given to using aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl tert-butyl ether, methyl tert-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or iso-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; esters, such as methyl acetate or ethyl acetate; sulphoxides, such as dimethylsulphoxide; or sulphones, such as sulfolane; alcohols, such as methanol, ethanol, n- or iso-propanol, n-, iso-, sec- or tert-butanol, ethanediol, propane-1,2-diol, ethoxyethanol, methoxyethanol, diethylene-glycolmonomethylether, diethyleneglycolmonoethylether; mixtures thereof with water or pure water.

Suitable acid binders for carrying out the processes (a), (b) and (c) according to the invention are all inorganic and organic bases customary for such reactions. Preference is given to using alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium

carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or di-azabicycloundecene (DBU).

Suitable acid binders for carrying out the processes (b), (c), (d) according to the invention are in each case all inorganic and organic bases customary for such reactions. Preference is given to using alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, fluorides, phosphates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium -amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium acetate, sodium phosphate, potassium phosphate, potassium fluoride, caesium fluoride, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium hydrogencarbonate, sodium hydrogencarbonate or caesium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU).

Suitable acids for carrying out the process (d3) according to the invention are all inorganic and organic acids customary for such reactions. Preference is given to using para-toluene sulfonic acid, methane sulfonic acid, hydrochloric acid (gas, aqueous or organic solution) or sulphuric acid.

Suitable condensing agents for carrying out the process (d1) according to the invention are all condensing agents customary for such amidation reactions. Preference is given to using acid halide former, such as phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; anhydride former, such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methanesulfonyl chloride; carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or other customary condensing agents, such as phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-tripyrrolidino-phosphonium-hexafluorophosphate.

Processes (a), (b) and (c) to the invention can be carried out in the presence of a catalyst. Preference is given to palladium salts or complexes, such as palladium chloride, palladium acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium, bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride or 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride.

It is also possible to generate a palladium complex directly in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand, such as triethylphosphane, tri-tert-butylphosphane, tricyclohexylphosphane, 2-(dicyclohexylphosphane)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphane)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphane)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphane, tris-(o-tolyl)phosphane, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphane, 2,2'-bis-(diphenylphosphane)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphane)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphane)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphane)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphane)ethane, 2-(dicyclohexylphosphane)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene or tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite.

When carrying out processes (d) according to the invention, the reaction temperature can be varied within a relatively wide range. In general, the process is carried out at temperatures between from 0°C to 150°C, preferably from 0°C to 120°C, particularly preferably from 10°C to 90°C.

When carrying out processes (a), (b), and according to the invention, the reaction temperatures can in each case be varied within a relatively wide range. In general, the processes are carried out at temperatures from 0°C to 180°C, preferably from 10°C to 150°C, particularly preferably from 20°C to 120°C.

When carrying out the process (a) according to the invention, in general 0.5 to 15 mole, preferably from 0.8 to 8 mole, of boronic acid derivative of the formula (IV) and from 1 to 5 mol of acid binder and from 0.2 to 5 mol% of catalyst are employed per mole of amine or amidine of the formula (IIa) or (Va). However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and the precipitate is separated off and dried. The residue that remains may, if appropriate, be freed of any impurities that may still be present using customary methods, such as chromatography or recrystallization.

When carrying out the process (b) according to the invention, in general 0.8 to 15 mole, preferably from 0.8 to 8 mole, of phenyl derivative of the formula (VI) and from 1 to 10 mol of acid binder and from 0.5 to 5 mole% of a catalyst are employed per mole of boronic acid derivative of the formula (IIb) or (Vb). However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and the precipitate is separated off and dried. The residue that remains may, if appropriate, be freed of any impurities that may still be present using customary methods, such as chromatography or recrystallization.

When carrying out the process (c) according to the invention, in general 0.8 to 15 mole, preferably from 0.8 to 8 mole, of amine or amidine derivative of the formula (IIa) or (Va) and from 0.8 to 15 mole, preferably from 0.8 to 8 mole, of 4,4,4',4',5,5,5',5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane and from 1 to 5 mol of acid binder and from 1 to 5 mol of a catalyst are employed per mole of phenyl derivative of the formula (VI). However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and the precipitate is separated off and dried. The residue that remains may, if appropriate, be freed of any impurities that may still be present using customary methods, such as chromatography or recrystallization.

10

When carrying out process (d1) according to the invention, per mole of the amine of the formula (VII) or (Va) in general 0.8 to 50 mole, preferably 1 to 10 mole of amide of the formula (VIII) and 1 to 10 mole of halogenation agent are employed. However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods.

15

When carrying out process (d2) according to the invention, per mole of the amine of the formula (VII) or (Va) in general 0.8 to 50 mole, preferably 1 to 10 mole of an aminoacetal of the formula (IX) are employed. However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods.

20

When carrying out process (d3) according to the invention, per mole of the amine of the formula (VII) or (Va) in general 0.8 to 50 mole, preferably 1 to 10 mole of an orthoester of the formula (XI) and 0.8 to 50 mole, preferably 1 to 10 mole of an amine of the formula (X) and a catalytic amount of acid are employed. However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods.

25

All processes according to the invention are generally each carried out under atmospheric pressure. However, in each case it is also possible to operate under elevated or reduced pressure – in general between 0,1 bar and 10 bar.

30

Compounds of formula (I) according to the invention can be prepared according to the herein described processes. It will nevertheless be understood that, on the basis of his general knowledge and of available publications, the skilled worker will be able to adapt these processes according to the specifics of each of the compounds which it is desired to synthesise.

35

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

The expression "effective and non-phytotoxic amount" means an amount of composition according to the invention which is sufficient to control or destroy the fungi present or liable to appear on the

23

crops, and which does not entail any appreciable symptom of phytotoxicity for the said crops. Such an amount can vary within a wide range depending on the fungus to be controlled, the type of crop, the climatic conditions and the compounds included in the fungicide composition according to the invention.

- 5 This amount can be determined by systematic field trials, which are within the capabilities of a person skilled in the art.

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

- 10 According to the invention, the term "support" denotes a natural or synthetic, organic or inorganic compound with which the active compound of formula (I) is combined or associated to make it easier to apply, notably to the parts of the plant. This support is thus generally inert and should be agriculturally acceptable. The support may be a solid or a liquid. Examples of suitable supports include clays, natural or synthetic silicates, silica, resins, waxes, solid fertilisers, water, 15 alcohols, in particular butanol, organic solvents, mineral and plant oils and derivatives thereof. Mixtures of such supports may also be used.

- The composition according to the invention may also comprise additional components. In particular, the composition may further comprise a surfactant. The surfactant can be an emulsifier, a dispersing agent or a wetting agent of ionic or non-ionic type or a mixture of such 20 surfactants. Mention may be made, for example, of polyacrylic acid salts, lignosulphonic acid salts, phenolsulphonic or naphthalenesulphonic acid salts, polycondensates of ethylene oxide with fatty alcohols or with fatty acids or with fatty amines, substituted phenols (in particular alkylphenols or arylphenols), salts of sulphosuccinic acid esters, taurine derivatives (in particular alkyl taurates), phosphoric esters of polyoxyethylated alcohols or phenols, fatty acid esters of 25 polyols, and derivatives of the present compounds containing sulphate, sulphonate and phosphate functions. The presence of at least one surfactant is generally essential when the active compound and/or the inert support are water-insoluble and when the vector agent for the application is water. Preferably, surfactant content may be comprised from 5% to 40% by weight of the composition.

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

- In general, the composition according to the invention may contain from 0.05 to 99% by weight 35 of active compound, preferably 10 to 70% by weight.

Compositions according to the invention can be used in various forms such as aerosol dispenser, bait (ready for use), bait concentrate, block bait, capsule suspension, cold fogging concentrate, dustable powder, emulsifiable concentrate, emulsion oil in water, emulsion water in oil, encapsulated granule, fine granule, flowable concentrate for seed treatment, gas (under

- pressure), gas generating product, grain bait, granular bait, granule, hot fogging concentrate, macrogranule, microgranule, oil dispersible powder, oil miscible flowable concentrate, oil miscible liquid, paste, plant rodlet, plate bait, powder for dry seed treatment, scrap bait, seed coated with a pesticide, smoke candle, smoke cartridge, smoke generator, smoke pellet, smoke rodlet, smoke tablet, smoke tin, soluble concentrate, soluble powder, solution for seed treatment, suspension concentrate (= flowable concentrate), tracking powder, ultra low volume (ulv) liquid, ultra low volume (ulv) suspension, vapour releasing product, water dispersible granules or tablets, water dispersible powder for slurry treatment, water soluble granules or tablets, water soluble powder for seed treatment and wettable powder.
- 5
- 10 These compositions include not only compositions which are ready to be applied to the plant or seed to be treated by means of a suitable device, such as a spraying or dusting device, but also concentrated commercial compositions which must be diluted before application to the crop.

- The compounds according to the invention can also be mixed with one or more insecticide, fungicide, bactericide, attractant, acaricide or pheromone active substance or other compounds with biological activity. The mixtures thus obtained have a broadened spectrum of activity.
- 15

The mixtures with other fungicide compounds are particularly advantageous. Examples of suitable fungicide mixing partners may be selected in the following lists :

- 20 B1) a compound capable to inhibit the nucleic acid synthesis like benalaxyl, benalaxyl-M, bupirimate, chiralaxyl, clozylacon, dimethirimol, ethirimol, furalaxyl, hymexazol, metalaxyl, metalaxyl-M, ofurace, oxadixyl, oxolinic acid ;

- B2) a compound capable to inhibit the mitosis and cell division like benomyl, carbendazim, diethofencarb, fuberidazole, pencycuron, thiabendazole thiophanate-methyl, zoxamide ;
- 25

B3) a compound capable to inhibit the respiration for example

as CI-respiration inhibitor like diflumetorim ;

as CII-respiration inhibitor like boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxycarboxine, penthiopyrad, thifluzamide ;

- 30 as CIII-respiration inhibitor like azoxystrobin, cyazofamid, dimoxystrobin, enestrobin, famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, pyraclostrobin, picoxystrobin, trifloxystrobin ;

B4) a compound capable of to act as an uncoupler like dinocap, fluazinam ;

B5) a compound capable to inhibit ATP production like fentin acetate, fentin chloride, fentin hydroxide, silthiofam ;

B6) a compound capable to inhibit AA and protein biosynthesis like andoprime, blasticidin-S, cyprodinil, kasugamycin, kasugamycin hydrochloride hydrate, mepanipyrim, pyrimethanil ;

B7) a compound capable to inhibit the signal transduction like fenpiclonil, fludioxonil, quinoxyfen ;

B8) a compound capable to inhibit lipid and membrane synthesis like chlozolinate, iprodione, procymidone, vinclozolin, pyrazophos, edifenphos, iprobenfos (IBP), isoprothiolane, tolclofos-methyl, biphenyl, iodocarb, propamocarb, propamocarb-hydrochloride ;

B9) a compound capable to inhibit ergosterol biosynthesis like fenhexamid, azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, diclobutrazole, difenoconazole, diniconazole, diniconazole-M, epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, furconazole, furconazole-cis, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, paclobutrazol, penconazole, propiconazole, prothioconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole, uniconazole, voriconazole, imazalil, imazalil sulfate, oxpoconazole, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pyrifenoxy, triforine, pefurazoate, prochloraz, triflumizole, viniconazole, aldimorph, dodemorph, dodemorph acetate, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamine, naftifine, pyributicarb, terbinafine ;

B10) a compound capable to inhibit cell wall synthesis like benthiavalicarb, bialaphos, dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, polyoxins, polyoxorim, validamycin A ;

B11) a compound capable to inhibit melanine biosynthesis like carpropamid, diclocymet, fenoxanil, phtalide, pyroquilon, tricyclazole ;

B12) a compound capable to induce a host defence like acibenzolar-S-methyl, probenazole, tiadinil ;

B13) a compound capable to have a multisite action like captan, chlorothalonil, copper preparations such as copper hydroxide, copper naphthenate, copper oxychloride, copper sulphate, copper oxide, oxine-copper and Bordeaux mixture, dichlofluanid, dithianon, dodine, dodine free base, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatine, guazatine acetate, iminoctadine, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, mancozeb, maneb,

metiram, metiram zinc, propineb, sulphur and sulphur preparations including calcium polysulphide, thiram, tolylfluanid, zineb, ziram ;

- B14) a compound selected in the following list: amibromdole, benthiazole, bethoxazin, capsimycin, carvone, chinomethionat, chloropicrin, cufraneb, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, debacarb, diclomezine, dichlorophen, dicloran, difenzoquat, difenzoquat methylsulphate, diphenylamine, ethaboxam, ferimzone, flumetover, flusulfamide, fosetyl-aluminium, fosetyl-calcium, fosetyl-sodium, fluopicolide, fluoroimide, hexachlorobenzene, 8-hydroxyquinoline sulfate, inumamycin, methasulphocarb, metrafenone, methyl isothiocyanate, mildiomycin, natamycin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothal-isopropyl, octhilinone, oxamocarb, oxyfenthin, pentachlorophenol and salts, 2-phenylphenol and salts, phosphorous acid and its salts, piperalin, propanosine-sodium, proquinazid, pyrrolnitrine, quintozone, tecloftalam, tecnazene, triazoxide, trichlamide, zarilamid and 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)-pyridine, N-(4-Chloro-2-nitrophenyl)-N-ethyl-4-methyl-benzenesulfonamide, 2-amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolecarboxamide, 2-chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, cis-1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)-cycloheptanol, methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate, 3,4,5-trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile, Methyl 2-[[[cyclopropyl[(4-methoxyphenyl)imino]methyl]thio]methyl]-.alpha.-(methoxymethylene)-benzeneacetate, 4-Chloro-alpha-propynyloxy-N-[2-[3-methoxy-4-(2-propynyloxy)phenyl]ethyl]-benzeneacetamide, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-N-[(1R)-1,2,2-trimethylpropyl][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, 5-chloro-N-[(1R)-1,2-dimethylpropyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloronicotinamide, N-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl-2,4-dichloronicotinamide, 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyranon-4-one, N-[(Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl]-2-phenylacetamide, N-(3-ethyl-3,5,5-trimethyl-cyclohexyl)-3-formylamino-2-hydroxy-benzamide, 2-[[[1-[3(1Fluoro-2-phenylethyl)oxy]phenyl]ethylidene]amino]oxy)methyl]-.alpha.-(methoxyimino)-N-methyl-.alpha.E-benzeneacetamide, N-[2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide, N-(3',4'-dichloro-5-fluorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, 2-(2-[[6-(3-chloro-2-methylphenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yl]oxy]phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylacetamide, 1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl-1H-imidazole-1-carboxylic acid, O-[1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl]-1H-imidazole-1-carbothioic acid.

27

The composition according to the invention comprising a mixture of a compound of formula (I) with a bactericide compound may also be particularly advantageous. Examples of suitable bactericide mixing partners may be selected in the following list : bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, octhilinone, furancarboxylic acid, oxytetracycline, probenazole, streptomycin, tectofofalam, copper sulphate and other copper preparations.

The compound of formula (I) and the fungicide composition according to the invention can be used to curatively or preventively control the phytopathogenic fungi of plants or crops. Thus, according to a further aspect of the invention, there is provided a method for curatively or preventively controlling the phytopathogenic fungi of plants or crops characterised in that a compound of formula (I) or a fungicide composition according to the invention is applied to the seed, the plant or to the fruit of the plant or to the soil wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.

In the same manner, the compound of formula (I) and the insecticide composition according to the invention can be used to curatively or preventively control damaging insects, notably of plants or crops. Thus, according to a further aspect of the invention, there is provided a method for curatively or preventively controlling damaging insects, notably of plants or crops, characterised in that a compound of formula (I) or an insecticide composition according to the invention is applied to the seed, the plant or to the fruit of the plant or to the soil wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.

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

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

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

Powdery mildew diseases such as :

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

Rust diseases such as :

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

Oomycete diseases such as :

- Bremia diseases, caused for example by *Bremia lactucae* ;
 Peronospora diseases, caused for example by *Peronospora pisi* or *P. brassicae* ;
 Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora infestans* ;
- 20 Plasmopara diseases, caused for example by *Plasmopara viticola* ;
 Pseudoperonospora diseases, caused for example by *Pseudoperonospora humuli* or
 Pseudoperonospora cubensis ;
 Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum* ;

Leafspot, leaf blotch and leaf blight diseases such as :

- 25 Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria solani* ;
 Cercospora diseases, caused for example by *Cercospora beticola* ;
 Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium cucumerinum* ;
 Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus* ;
 Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum* ;
- 30 Cycloconium diseases, caused for example by *Cycloconium oleaginum* ;
 Diaporthe diseases, caused for example by *Diaporthe citri* ;
 Elsinoe diseases, caused for example by *Elsinoe fawcettii* ;
 Gloeosporium diseases, caused for example by *Gloeosporium laeticolor* ;
 Glomerella diseases, caused for example by *Glomerella cingulata* ;
- 35 Guignardia diseases, caused for example by *Guignardia bidwelli* ;
 Leptosphaeria diseases, caused for example by *Leptosphaeria maculans* ; *Leptosphaeria*
 nodorum ;
 Magnaporthe diseases, caused for example by *Magnaporthe grisea* ;

- 29
- Mycosphaerella diseases, caused for example by *Mycosphaerella graminicola* ;
Mycosphaerella arachidicola ; *Mycosphaerella fijiensis* ;
 Phaeosphaeria diseases, caused for example by *Phaeosphaeria nodorum* ;
 Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora teres* ;
 5 Ramularia diseases, caused for example by *Ramularia collo-cygni* ;
 Rhynchosporium diseases, caused for example by *Rhynchosporium secalis* ;
 Septoria diseases, caused for example by *Septoria apii* or *Septoria lycopersici* ;
 Typhula diseases, caused for example by *Typhula incarnata* ;
 Venturia diseases, caused for example by *Venturia inaequalis* ;
 10 Root and stem diseases such as :
 Corticium diseases, caused for example by *Corticium graminearum* ;
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium oxysporum* ;
 Gaeumannomyces diseases, caused for example by *Gaeumannomyces graminis* ;
 Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani* ;
 15 Tapesia diseases, caused for example by *Tapesia acuformis* ;
 Thielaviopsis diseases, caused for example by *Thielaviopsis basicola* ;
 Ear and panicle diseases such as :
 Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria spp.* ;
 Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus* ;
 20 Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium spp.* ;
 Claviceps diseases, caused for example by *Claviceps purpurea* ;
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum* ;
 Gibberella diseases, caused for example by *Gibberella zeae* ;
 Monographella diseases, caused for example by *Monographella nivalis* ;
 25 Smut and bunt diseases such as :
 Sphacelotheca diseases, caused for example by *Sphacelotheca reiliana* ;
 Tilletia diseases, caused for example by *Tilletia caries* ;
 Urocystis diseases, caused for example by *Urocystis occulta* ;
 Ustilago diseases, caused for example by *Ustilago nuda* ;
 30 Fruit rot and mould diseases such as :
 Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus* ;
 Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea* ;
 Penicillium diseases, caused for example by *Penicillium expansum* ;
 Sclerotinia diseases, caused for example by *Sclerotinia sclerotiorum* ;
 35 Verticillium diseases, caused for example by *Verticillium albo-atrum* ;
 Seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off diseases :
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum* ;
 Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora cactorum* ;
 Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum* ;

- Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani* ;
 Sclerotium diseases, caused for example by *Sclerotium rolfsii* ;
 Microdochium diseases, caused for example by *Microdochium nivale* ;
 Canker, broom and dieback diseases such as :
- 5 Nectria diseases, caused for example by *Nectria galligena* ;
 Blight diseases such as :
 Monilinia diseases, caused for example by *Monilinia laxa* ;
 Leaf blister or leaf curl diseases such as :
 Taphrina diseases, caused for example by *Taphrina deformans* ;
- 10 Decline diseases of wooden plants such as :
 Esca diseases, caused for example by *Phaemoniella clamydospora* ;
 Eutypa dieback, caused for example by *Eutypa lata* ;
 Dutch elm disease, caused for example by *Ceratocystis ulmi* ;
 Diseases of flowers and Seeds such as :
- 15 Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea* ;
 Diseases of tubers such as :
 Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*.
- Among the damaging pests or insects that can be controlled at any development stage
 20 according to the insecticide method of the invention, mention may be made to :
- the order of the *Anoplura* (*Phthiraptera*), for example, *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.;
 - the class of the *Arachnida*, for example, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*;
 - the class of the *Bivalva*, for example, *Dreissena* spp.;
 - the order of the *Chilopoda*, for example, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;
 - the order of the *Coleoptera*, for example, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorrhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus*
- 35

5 *cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizophorthera dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Stemecus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp.,

10 *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp..

- the order of the *Collembola*, for example, *Onychiurus armatus*;
- the order of the *Dermaptera*, for example, *Forficula auricularia*;
- the order of the *Diplopoda*, for example, *Blaniulus guttulatus*;
- the order of the *Diptera*, for example, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*,
- 15 *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp.,
- 20 *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp;

- the class of the *Gastropoda*, for example, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.;
- the class of the *helminths*, for example, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp.,
- 25 *Brugia malayi*, *Brugia timoni*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphylobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp.,
- 30 *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*;

- 35 • Protozoa, such as *Eimeria*;
- the order of the *Heteroptera*, for example, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasyneus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus*

- spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp.,
5 *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;
- the order of the *Homoptera*, for example, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*,
10 *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Delbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp.,
15 *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp.,
20 *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia prae-longa*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria pyrifomis*,
25 *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioxa* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*;
 - the order of the *Hymenoptera*, for example, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.;
 - the order of the *Isopoda*, for example, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
 - 35 • the order of the *Isoptera*, for example, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.;
 - the order of the *Lepidoptera*, for example, *Acrionicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*,

- Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*,
Euxoa spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hof-*
mannophila pseudospretella, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma*
 spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria*
 5 spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*,
Oria spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis*
citrella, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia*
includens, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea*
pellionella, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.;
- 10 • the order of the Orthoptera, for example, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella*
germanica, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp.,
Periplaneta americana, *Schistocerca gregaria*;
 - the order of the Siphonaptera, for example, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.
 - the order of the Symphyla, for example, *Scutigerella immaculata*;
 - 15 • the order of the Thysanoptera, for example, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*,
Frankliniella spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp.,
Rhipiphorothrips cruentatus, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.;
 - the order of the Thysanura, for example, *Lepisma saccharina*;
 - the phytoparasitic nematodes including for example, *Anguina* spp., *Aphelenchoides*
 20 spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp.,
Helicocotylenchus spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp.,
Pratylenchus spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp.,
Tylenchorhynchus spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.;
 - the beetles, such as *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*,
 25 *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Emobius mollis*,
Priobium carpini, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*,
Lyctus pubescens, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*
Tryptodendron spec. *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus*
brunneus, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;
 - 30 • Hymenopterons, such as *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*,
Urocerus augur;
 - termites, such as *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*,
Reticuliterms flavipes, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Masto-*
termes darwiniensis, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*;
 - 35 • Bristletails, such as *Lepisma saccharina*;
 - the order of the Acarina, for example, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*,
Dermanyssus gallinae, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus*

sanguineus, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*;

- the order of the *Araneae*, for example, *Aviculariidae*, *Araneidae*;
- the order of the *Opiliones*, for example, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;
- the order of the *Isopoda*, for example, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- the order of the *Diplopoda*, for example, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*;
- the order of the *Chilopoda*, for example, *Geophilus spp.*;
- the order of the *Zygentoma*, for example, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*;
- the order of the *Blattaria*, for example, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*;
- the order of the *Saltatoria*, for example, *Acheta domesticus*;
- the order of the *Dermaptera*, for example, *Forficula auricularia*;
- the order of the *Isoptera*, for example, *Kaloterms spp.*, *Reticuliterms spp.*;
- the order of the *Psocoptera*, for example, *Lepinatus spp.*, *Liposcelis spp.*;
- the order of the *Coleoptera*, for example, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Dermestes spp.*, *Latheticus oryzae*, *Necrobia spp.*, *Ptinus spp.*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- the order of the *Diptera*, for example, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila spp.*, *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus spp.*, *Sarcophaga carnaria*, *Simulium spp.*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;
- the order of the *Lepidoptera*, for example, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*;
- the order of the *Siphonaptera*, for example, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- the order of the *Hymenoptera*, for example, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula spp.*, *Tetramorium caespitum*;
- the order of the *Anoplura*, for example, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus spp.*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*;
- the order of the *Heteroptera*, for example, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

35

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

10 The dose of active compound usually applied in the method of treatment according to the invention is generally and advantageously from 10 to 800 g/ha, preferably from 50 to 300 g/ha for applications in foliar treatment. The dose of active substance applied is generally and advantageously from 2 to 200 g per 100 kg of seed, preferably from 3 to 150 g per 100 kg of seed in the case of seed treatment.

15 It is clearly understood that the doses indicated herein are given as illustrative examples of the method according to the invention. A person skilled in the art will know how to adapt the application doses, notably according to the nature of the plant or crop to be treated.

20 The fungicide or insecticide composition according to the invention may also be used in the treatment of genetically modified organisms with the compounds according to the invention or the agrochemical compositions according to the invention. Genetically modified plants are plants into genome of which a heterologous gene encoding a protein of interest has been stably integrated. The expression "heterologous gene encoding a protein of interest" essentially means genes which give the transformed plant new agronomic properties, or genes for improving the agronomic quality of the modified plant.

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

30 The various aspects of the invention will now be illustrated with reference to the following tables of compounds examples. The following tables illustrate in a non-limiting manner examples of compounds according to the invention.

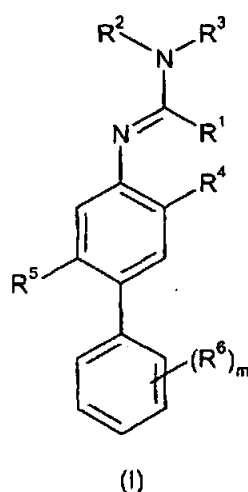
35 In the following examples, M+1 (or M-1) means the molecular ion peak, plus or minus 1 a.m.u. (atomic mass unit) respectively, as observed in mass spectroscopy and M (Apcl+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy.

In the following examples, the logP values were determined in accordance with EEC Directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) on a reversed-phase column (C 18), using the method described below :

Temperature: 40°C ; Mobile phases : 0.1% aqueous formic acid and acetonitrile ; linear gradient from 10% acetonitrile to 90% acetonitrile.

Calibration was carried out using unbranched alkan-2-ones (comprising 3 to 16 carbon atoms) with known logP values (determination of the logP values by the retention times using linear interpolation between two successive alkanones).

The lambda max values were determined in the maxima of the chromatographic signals using the UV spectra from 190nm to 400nm.



(I)

Table 1 :

No.	R1	R2	R3	R1.	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
							ortho	meta	para	meta'	
1	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	tBu	H	2.44
2	H	Me	Et	H	CF3	H	H	H	tBu	H	2.83
3	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Cl	F	H	1.92
4	H	Me	Et	H	CF3	H	H	Cl	F	H	2.36
5	H	Me	Et	H	Me	H	H	Cl	F	H	2.00
6	H	Me	Et	H	F	H	H	H	tBu	H	2.29
7	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	tBu	H	2.66
8	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	tBu	H	2.67
9	H	Me	Et	H	F	H	H	Cl	F	H	1.78
10	H	Me	Et	H	Et	H	H	Cl	F	H	2.17
11	H	Me	Et	H	CF3	H	OMe	OMe	OMe	H	1.84
12	H	Me	Et	H	F	H	OMe	OMe	OMe	H	1.50
13	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	F	H	1.69
14	H	Me	Et	H	CF3	H	H	H	F	H	1.93
15	H	Me	Et	H	F	H	H	H	F	H	1.50
16	H	Me	Et	H	Me	H	H	CF3	Cl	H	2.28
17	H	Me	Et	H	Me	Me	H	CF3	Cl	H	2.40
18	H	Me	Et	H	Cl	H	H	CF3	Cl	H	2.19
19	H	Me	Et	H	CF3	H	H	CF3	Cl	H	2.90
20	H	Me	Et	H	F	H	H	CF3	Cl	H	2.15
21	H	Me	Et	H	Et	H	H	CF3	Cl	H	2.39
22	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	F	H	1.95
23	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	F	H	1.79
24	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	CF3	H	1.99
25	H	Me	Et	H	CF3	H	H	H	CF3	H	2.54
26	H	Me	Et	H	F	H	H	H	CF3	H	1.87
27	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	CF3	H	2.20
28	SH	Me	Et	SH	Me	Me	H	H	tBu	H	4.58
29	H	Me	Et	H	Me	H	H	OMe	OMe	OMe	1.56
30	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	C=NOMe	H	1.94
31	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CMe=NOMe	H	2.02
32	H	Me	Et	H	Me	H	H	Cl	Cl	H	2.21
33	H	Me	Et	H	Me	H	H	Me	F	H	2.04
34	H	Me	Et	H	Me	H	H	F	F	H	1.89
35	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	OPh	H	2.41
36	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	OCH2Ph	H	2.46
37	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CH2OMe	H	1.59
38	H	Me	Et	H	Me	H	H	OMe	OMe	H	1.49
39	H	Me	Et	H	Me	Me	H	OMe	OMe	OMe	1.68
40	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	C=NOMe	H	2.05
41	H	Me	Et	H	Me	Me	H	F	Cl	H	2.32
42	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CMe=NOMe	H	2.24
43	H	Me	Et	H	Me	Me	F	F	F	H	2.32
44	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	Cl	H	2.27
45	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Me	F	H	2.08
46	H	Me	Et	H	Me	Me	H	F	F	H	1.98
47	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OPh	H	2.56
48	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OCH2Ph	H	2.55
49	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CH2OMe	H	1.76
50	H	Me	Et	H	Et	H	H	OMe	OMe	OMe	1.69
51	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	C=NOMe	H	2.09
52	H	Me	Et	H	Et	H	H	F	Cl	H	2.31
53	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	CMe=NOMe	H	2.18
54	H	Me	Et	H	Et	H	H	Cl	Cl	H	2.37
55	H	Me	Et	H	Et	H	H	Me	F	H	1.98
56	H	Me	Et	H	Et	H	H	F	F	H	2.00
57	H	Me	Et	H	Et	H	Cl	H	Cl	H	2.26

No.	Σ	R2	R3	R1	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
							ortho	meta	para	meta'	
58	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	OMe	H	1.90
59	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	OPh	H	2.32
60	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.39
61	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	CH ₂ OMe	H	1.67
62	H	Me	Et	H	Et	H	H	OMe	OMe	H	1.68
63	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OMe	OMe	OMe	1.58
64	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	C=NOMe	H	1.87
65	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	CMe=NOMe	H	2.00
66	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Cl	Cl	H	2.25
67	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Me	F	H	2.10
68	H	Me	Et	H	Cl	H	H	F	F	H	1.83
69	H	Me	Et	H	Cl	H	Cl	H	Cl	H	2.32
70	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	OMe	H	1.71
71	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	OPh	H	2.45
72	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.48
73	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	CH ₂ OMe	H	1.65
74	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OMe	OMe	H	1.54
75	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OMe	OMe	OMe	1.79
76	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	C=NOMe	H	2.01
77	H	Me	Et	H	F	H	H	H	C=NOMe	H	1.73
78	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	CMe=NOMe	H	2.24
79	H	Me	Et	H	CF ₃	H	F	F	F	H	2.29
80	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	Br	H	2.24
81	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	Cl	Cl	H	2.57
82	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	Me	F	H	2.20
83	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	F	F	H	2.09
84	H	Me	Et	H	F	H	H	F	F	H	1.68
85	H	Me	Et	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	H	2.39
86	H	Me	Et	H	F	H	Cl	H	Cl	H	2.05
87	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	OMe	H	1.78
88	H	Me	Et	H	F	H	H	H	OMe	H	1.59
89	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	OPh	H	2.65
90	H	Me	Et	H	F	H	H	H	OPh	H	2.20
91	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.43
92	H	Me	Et	H	F	H	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.27
93	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	H	CH ₂ OMe	H	1.76
94	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OMe	OMe	H	1.71
95	H	Me	Et	H	F	H	H	OMe	OMe	H	1.41
96	H	Me	Et	H	H	Cl	H	Cl	H	H	1.92
97	H	Me	Et	H	OMe	OMe	H	Cl	OMe	H	1.83
98	H	Me	Et	H	OMe	OMe	H	H	Me	H	1.89
99	H	Me	Et	H	Me	F	H	H	Cl	H	2.23
100	H	Me	Et	H	H	Cl	H	H	OCF ₃	H	2.15
101	H	Me	iPr	H	H	Cl	H	Cl	H	H	2.04
102	H	Me	iPr	H	OMe	OMe	H	Cl	OMe	H	1.95
103	H	Me	iPr	H	OMe	OMe	H	H	Me	H	2.01
104	H	Me	iPr	H	Me	F	H	H	Cl	H	2.22
105	H	Me	iPr	H	H	Cl	H	H	OCF ₃	H	2.42

39

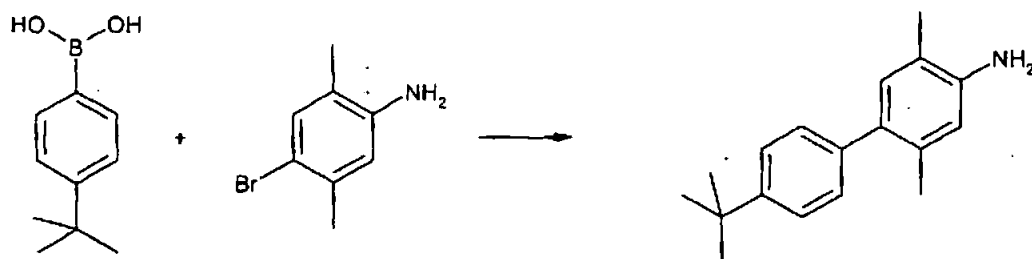
No.	R1	R2	R3	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
						ortho	meta	para	meta'	
106	H	Me	Et	H	Cl	Me	H	tBu	H	2.71
107	H	Me	Et	H	Cl	Me	H	CF3	Cl	2.30
108	H	Me	Et	H	Me	H	H	Me	Cl	2.14
109	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Me	Cl	2.27
110	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Me	Cl	2.13
111	H	Me	Et	H	Me	H	Me	H	Cl	2.23
112	H	Me	Et	H	Me	Me	Me	H	Cl	2.24
113	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	H	Cl	2.03
114	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Me	OMe	2.05
115	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Me	OMe	1.86
116	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	tBu	2.69
117	H	CH2CH2CH2CH2CH(CH3)		H	Me	Me	H	H	tBu	3.02
118	H	CH2CH2OCH2CH2		H	Me	Me	H	H	tBu	2.53
119	H	CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	tBu	2.79
120	CH2CH2CH2	H	CH2CH2CH2		Me	Me	H	H	tBu	2.53
121	CH2CH2CH2CH2	H	CH2CH2CH2CH2		Me	Me	H	H	tBu	2.60
122	NHCH2CH2CH2	H	NHCH2CH2CH2		Me	Me	H	H	Cl	2.08
123	NHCH2CH2CH2	H	NHCH2CH2CH2		Me	Me	H	H	F	1.81
124	NHCH2CH2	H	NHCH2CH2		Me	Me	H	H	F	1.72
125	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	Cl	2.18
126	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	F	1.84
127	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CF3	2.17
128	H	Me	Et	H	Me	H	H	Cl	H	2.01
129	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	tBu	2.67
130	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CN	1.54
131	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	Me	2.01
132	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CF3	2.19
133	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	H	2.15
134	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	H	1.77
135	H	Me	Et	H	Me	Me	-CH=CH-CH=CH-		H	2.13
136	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CN	1.54
137	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	F	2.02
138	CH2CH2CH2CH2	H	CH2CH2CH2CH2		Me	H	H	H	tBu	2.45
139	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CMe=NOEt	2.55
140	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	H	CMe=NOEt	2.60
141	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	CMe=NOEt	2.22
142	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	CF3	2.59
143	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	Cl	CF3	2.69
144	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	Cl	CF3	2.70
145	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	Cl	CF3	2.76
146	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	Me	2.37
147	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	Cl	Me	2.56
148	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	Cl	Me	2.48
149	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	Cl	Me	2.53
150	H	CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	Cl	Me	2.37
151	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	SiMe3	2.98
152	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	H	SiMe3	3.10
153	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	H	SiMe3	3.08
154	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	SiMe3	3.16
155	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	iPr	2.34
156	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	H	iPr	2.70

No.	R	R2	R3	R1	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
							ortho	meta	para	meta'	
157	H	Me	Amyl	H	Me	Me	H	H	iPr	H	2.60
158	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	iPr	H	2.60
159	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	1-Me-1-MeO-Pr	H	2.38
160	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OBu	H	2.28
161	H	Me	iPr	H	Me	Me	H	H	tBu	H	2.77
162	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	iBu	H	2.84
163	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	sBu	H	2.92
164	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Br	tBu	H	3.13
165	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	cyclohexyl	H	3.18
166	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CH2SiMe3	H	3.18
167	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	cyclopentyl	H	2.94
168	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	tBu	H	2.85
169	H	Me	iPr	H	Me	Me	H	F	tBu	H	2.74
170	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OPr	H	2.18
171	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	OPr	H	2.62
172	H	Me	Et	H	Me	Me	H	F	OPr	H	2.37
173	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	SO2NMe2	H	1.76
174	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	SO2CF3	H	2.21
175	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	Br	H	2.20
176	Me	Me	Et	Me	Me	Me	H	H	tBu	H	2.77
177	H	Me	Et	H	Me	CN	H	H	tBu	H	2.21
178	H	Me	Et	H	Me	Me	H	iPr	H	H	2.42
179	H	Me	Et	H	Me	Me	H	SiMe3	H	H	3.00

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

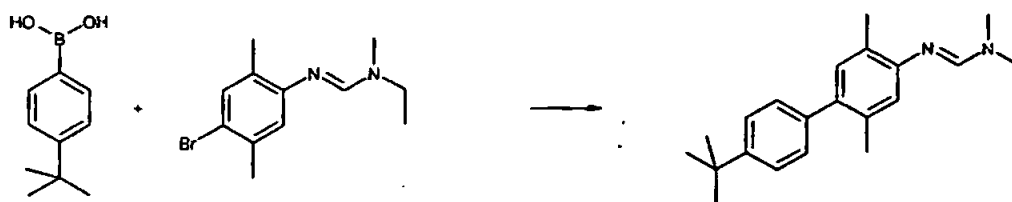
5

Preparation example 1 - Process (a) - compound (IIa) to compound (VII) : 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine - intermediate (VII-1)



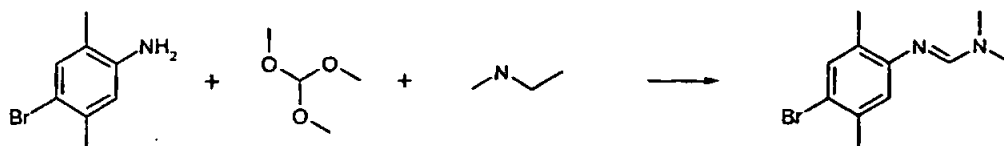
The reaction is carried out using inert conditions (argon or nitrogen atmosphere, dry solvents). A suspension of 6.4 g (36.0 mmol) of (4-tert-butylphenyl)boronic acid, 6.0 g (30.0 mmol) of 4-bromo-2,5-dimethylaniline, 29.3 g (90 mmol) caesium carbonate and 0.7 g (0.6 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)palladium in 75 ml of 1,2-dimethoxyethan was stirred for 16 hrs at 80°C. At room temperature 25 ml of water and 75 ml of toluene were added. The organic layer was separated, the watery layer was again extracted using 75 ml of toluene. The combined organic layers were dried over magnesium sulfate and concentrated *in vacuo*. Column chromatographie (cyclohexane / ethylacetate : 2/1) yielded 5.5g (21,7 mmol) 72 % of 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine (log P (pH 2.3) = 3.65).

Preparation example 2 - Process (a) - compound (Va) to compound (I) : N'-(4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-yl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide - compound 8



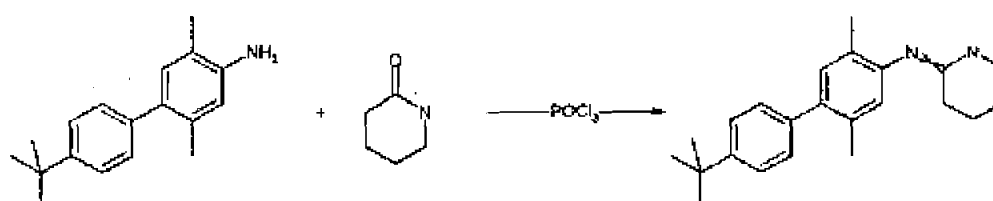
The reaction is carried out using inert conditions (argon or nitrogen atmosphere, dry solvents). A suspension of 0.3 g (1.8 mmol) of (4-tert-butylphenyl)boronic acid, 0.4 g (1.5 mmol) of N'-(4-bromo-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide, 1.5 g (4.5 mmol) caesium carbonate and 0.03 g (0.03 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)palladium in 3.5 ml of 1,2-dimethoxyethan was stirred for 16 hrs at 80°C. At room temperature 5 ml of water and 15 ml of toluene were added. The organic layer was separated, the watery layer was again extracted using 15 ml of toluene. The combined organic layers were dried over magnesium sulfate and concentrated *in vacuo*. Column chromatographie (cyclohexane / acetone : 4/1) yielded 0.23g (0.7 mmol) 47 % of N'-(4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-yl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide; log P (pH 2.3) = 2.67.

Preparation example 3 - Process (d3) - compound (IIa) to compound (Va) : N'-(4-bromo-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide - intermediate (Va-1)



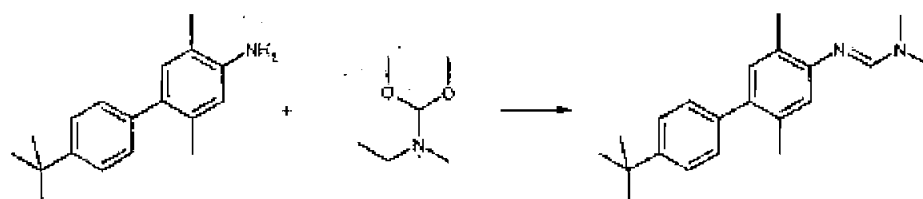
To a mixture of 10.0 g (50 mmol) of 4-bromo-2,5-dimethylaniline and 126 ml (1.15 mol) of trimethoxymethane 0.86 g (5 mmol) of p-toluene sulfonic acid were added. The reaction mixture was refluxed for 16 hrs and concentrated *in vacuo*. The crude product was solved in 50 ml of dichloro methane and 5.9 g (100 mmol) N-methylethanamine were added. The reaction mixture was stirred for 16 hrs at room temperatur. The reaction mixture was concentrated *in vacuo*. Column chromatographie (gradient: petroleum ether -> methyl-tert. butyl ether) yielded 5.2 g (19.5 mmol) 39 % of N'-(4-bromo-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide ; log P (pH 2.3) = 1.36.

Preparation example 4 - Process (d1) - compound (VII) to compound (I) : 4'-tert-butyl-2,5-dimethyl-N-[piperidin-2-ylidene]biphenyl-4-amine - compound 121



A solution of 0.2g (1.5 mmol) of phosphoric trichloride in 5 ml toluene was added to a mixture of 0.3 g (3.0 mmol) of piperidin-2-one, the exothermic reaction was stirred for 2 hrs at ambient temperature. Then a solution of 0.38 g (1.5 mmol) of 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine in 5 ml of toluene was added and the reaction mixture was refluxed for 5 hrs. At ambient temperature 5 ml of a 10% aqueous solution of sodium hydroxide was added. Separation of the layers, extraction of the watery layer with 10 ml of toluene, drying over magnesium sulfate, concentration *in vacuo* and column chromatographie (gradient: cyclohexane -> ethyl acetate) yielded 0.3g (1.0 mmol) 63 % of 4'-tert-butyl-2,5-dimethyl-N-[piperidin-2-ylidene]biphenyl-4-amine; log P (pH 2.3) = 2.6.

Preparation example 5 - Process (d2) - compound (VII) to compound (I) : N'-(4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-yl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide - compound 8



To a mixture of 2.1 g (6.3 mmol) of 4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-amine in 2.5 ml methanol a solution of 8.8 mmol of N-(dimethoxymethyl)-N-methylethanamine (60% in methanol) was added. The reaction mixture was stirred for 24 hrs at 45°C. The reaction mixture was concentrated *in vacuo*. Column chromatographie (gradient: cyclohexane -> ethyl acetate) yielded 0.96g (3.0 mmol) 47 % of N'-(4'-tert-butyl-2,5-dimethylbiphenyl-4-yl)-N-ethyl-N-methylimidoformamide; log P (pH 2.3) = 2.67.

Efficacy example A : *in vivo* preventive test on *Puccinia recondita* f. Sp. *tritici* (wheat brown rust).

Solvent: 50 parts by weight of n,n-dimethylacetamid
 25 Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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

To test for preventive activity, young plants are inoculated with a spore suspension of *Puccinia recondita* in a 0.1% strength aqueous agar solution. After the spray coating has dried on, the plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. The plants remain for 24 hours in an incubation cabinet at 20°C and a relative atmospheric humidity of 100%.

The plants are placed in a greenhouse at a temperature of approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 80% to promote the development of rust pustules.

The test is evaluated 10 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the following compounds according to the invention showed an efficacy of 70% or even higher at a concentration of 1000ppm of active ingredient : 1, 2, 3, 7, 8, 10, 16, 17, 21, 28, 31, 33, 34, 35, 39, 4, 47, 64, 73, 96, 97, 98, 106, 107, 108, 109, 110, 112, 114, 115, 116, 122, 123, 125, 127, 129, 131, 132, 133, 136, 145, 146, 149, 151, 155, 156, 160, 162, 163, 164, 165, 167, 169.

Efficacy example B : in vivo preventive test on *Erysiphe graminis* (Powdery mildew on Barley)

Solvent: 50 parts by weight of n,n-dimethylacetamid

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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

To test for preventive activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound or active compound combination at the stated rate of application.

After the spray coating has dried on, the plants are dusted with spores of *Erysiphe graminis* f.sp. *hordei*.

The plants are placed in a greenhouse at a temperature of approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 80% to promote the development of mildew pustules.

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

In this test the following compounds according to the invention showed an efficacy of 70% or even higher at a concentration of 1000ppm of active ingredient : 1, 2, 7, 8, 10, 17, 18, 21, 28, 31,

33, 34, 35, 40, 47, 73, 96, 97, 100, 106, 107, 108, 109, 112, 114, 115, 116, 123, 127, 129, 132, 133, 138.

Efficacy example C : in vivo protective test on *Alternaria solani* (Leaf spot of tomato)

- 5 Solvent: 49 parts by weight of N, N-dimethylformamide
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycoether

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

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Alternaria solani*. The plants remain for one day in an
15 incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 100%. Then the plants are placed in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 96%.

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

In this test, invention related compounds of the following formula revealed an efficacy of 70% or higher at a concentration of 500 ppm of active ingredient : 8, 31, 35, 36, 39, 40, 41, 43, 47, 76, 77, 78, 106, 119, 123, 129, 132, 133.

25 Efficacy example D : in vivo protective test on *Podosphaera leucometra* (apples).

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

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

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound
35 at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the causal agent of apple mildew (*Podosphaera leucometra*). The plants are then placed in a greenhouse at approximately 23°C and a relative atmospheric humidity of approximately 70%.

The test is evaluated 10 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

In this test the compounds according to the invention of the following structures showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 100ppm of active ingredient : 1, 8, 27, 28, 40, 106,
5 112, 129, 132, 133, 155, 160.

Efficacy example E : in vivo protective test on *Sphaerotheca fuliginea* (cucumbers)

Solvent: 24,5 parts by weight of acetone

24,5 parts by weight of dimethylacetamide

10 Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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

15

To test for protect activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Sphaerotheca fuliginea*. The plants are then placed in a greenhouse at approximately 23°C and a relative atmospheric humidity of approximately 70 %.

20

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

In this test the compounds according to the invention of the following structures showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 100ppm of active ingredient : 1, 8, 17, 27, 28, 40,
25 106, 112, 114, 122, 123, 124, 129, 132, 133, 145, 155.

Efficacy example F : in vivo protective test on *Botrytis cinerea* (beans)

Solvent: 24,5 parts by weight of acetone

24,5 parts by weight of dimethylacetamide

30 Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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

35

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound. After the spray coating has dried on, 2 small pieces of agar covered with growth of *Botrytis cinerea* are placed on each leaf. The inoculated plants are placed in a darkened chamber at 20°C and a relative atmospheric humidity of 100%.

2 days after the inoculation, the size of the lesions on the leaves is evaluated. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

- 5 In this test the compounds according to the invention of the following structures showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 500ppm of active ingredient: 8, 40, 47, 106, 129, 132, 133.

Efficacy example G : in vivo protective test on *Uromyces appendiculatus* (beans)

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

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

- 20 To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the causal agent of bean rust (*Uromyces appendiculatus*) and then remain for 1 day in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 100 %.

- 25 The plants are then placed in a greenhouse at approximately 21°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90 %.

The test is evaluated 10 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

- 30 In this test the compounds according to the invention of the following structures showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 100ppm of active ingredient : 129, 132, 133, 155, 160.

Efficacy example H : in vivo protective test on *Aedes Aegypti* (AEDSAE U)

- 35 Solvent: 1 % N-methylpyrrolidone (NMP)
1 % diacetonealcohol
Dye: brillantsulfoflavin for staining water

To produce a suitable preparation of the active compound, the active compound is mixed with the stated amount of solvent, and the concentrate is diluted with staining water to the desired concentration.

5 *Aedes aegypti* larvae are pipetted with a preparation of active ingredient of the desired concentration.

After the specified period of time, mortality in % is determined. 100% means that all larvae have been killed, a 0% means that none of the larvae have been killed.

In this test, the following compounds from the preparation example show good activity: 9, 18, 19, 26, 47, 54, 77, 99, 100, 104, 105, 127, 128, 129.

10

Efficacy example I: *Heliothis virescens* –Test on *Heliothis virescens* (HELV) spray application):

Solvent: 78 parts by weight acetone

1.5 parts by weight dimethylformamide

Wetting agent 0.5 parts by weight alkylaryl/polyglycoether

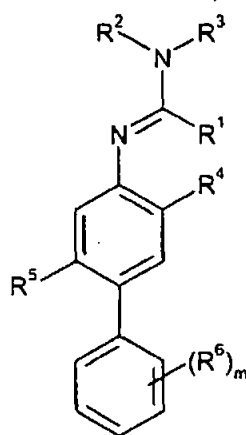
15 To produce a suitable preparation of the active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Soybean (*Glycine max.*) leaf sections are sprayed with a preparation of the active ingredient of the desired concentration. Once dry, the leaf sections are infested with eggs of cotton bollworm
20 (*Heliothis virescens*).

After the specified period of time, mortality in % is determined. 100% means that all eggs have been killed and 0% means that none of the eggs have been killed.
In this test for example, the following compound from the preparation examples showed good activity: 26.

CLAIMS

1. A phenyl-amidine derivative of formula (I):



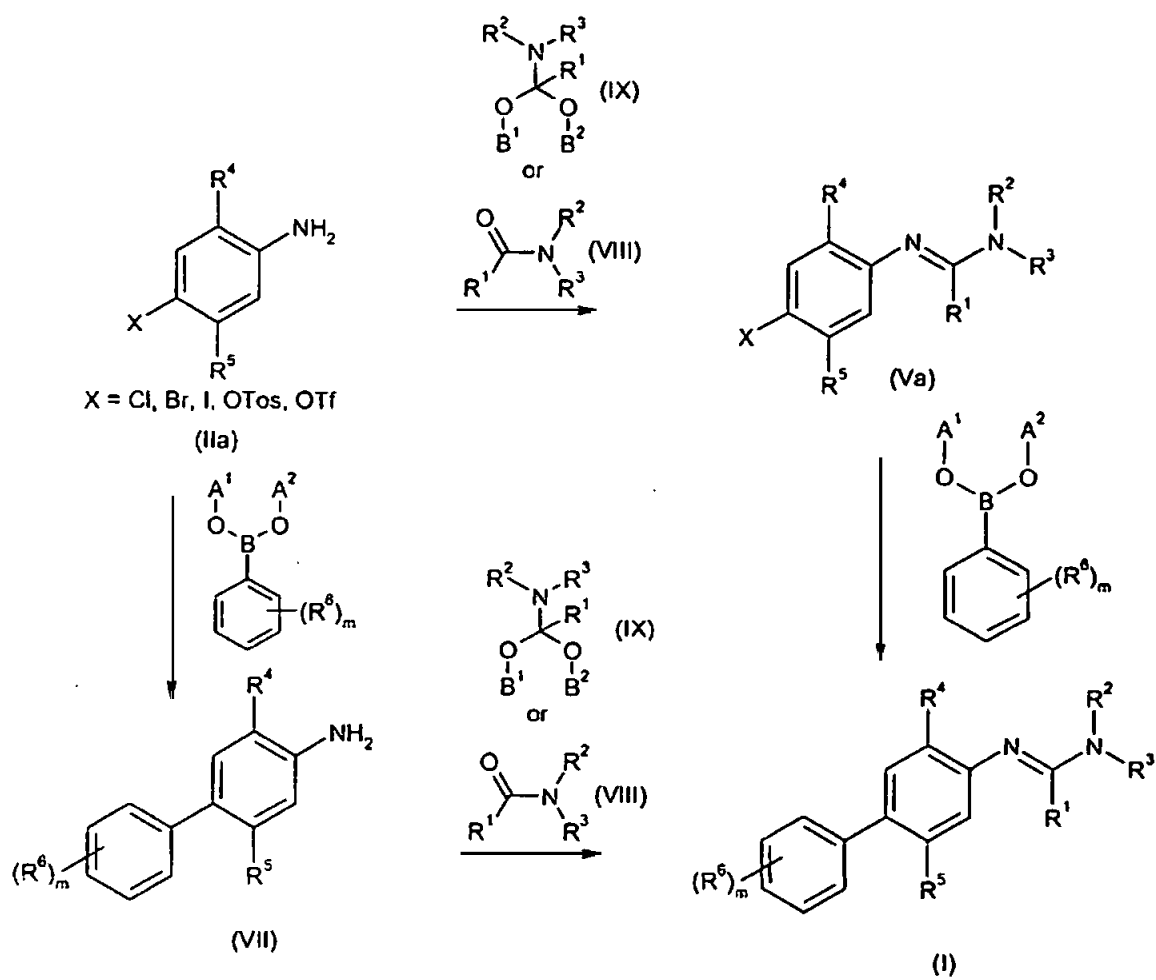
(I)

wherein

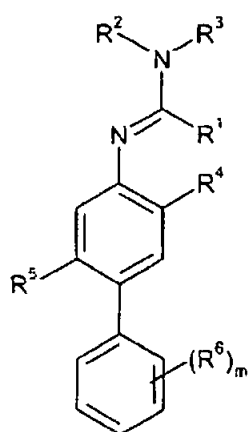
- R^1 represents H, a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkenyl, a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkynyl, SH or a substituted or non substituted S- C_1 - C_{12} -alkyl ;
- R^2 represents a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl ;
- R^3 represents a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted C_3 - C_6 -cycloalkyl, substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkenyl, substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkynyl, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl ;
- R^1 and R^2 , R^1 and R^3 or R^2 and R^3 can form together a substituted or non substituted 5 to 7-membered heterocycle ;
- R^4 represents a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a halogen atom, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted O- C_1 - C_{12} -alkyl or cyano ;
- R^5 represents H, a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a halogen atom, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted O- C_1 - C_{12} -alkyl or cyano ;
- R^6 represents H, a halogen atom, nitro, cyano, trialkylsilyl, C_1 - C_8 -alkyl, substituted or non-substituted C_1 - C_4 -alkyl-phenyl, substituted or non-substituted phenyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_8 -alkylthio, C_1 - C_6 -halogenoalkyl, C_1 - C_6 -halogenalkoxy, C_1 - C_6 -halogenoalkylthio, substituted or non substituted C_1 - C_4 -alkoxy-phenyl like benzyloxy, substituted or non substituted phenoxy, substituted, non substituted alkylamino- C_1 - C_8 - NR^7R^8 , substituted, non substituted NR^7R^8 , C_1 - C_8 -alkyl- $S(O)_nR^9$, - $S(O)_nR^9$, C_1 - C_8 -alkyl- $SO_2NR^7R^8$, - $SO_2NR^7R^8$, C_1 - C_8 -alkyl- $C(O)R^{10}$, - $CR^9=N-O-R^{11}$; or
- two substituents R^6 may form a carbocyclic or heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ;

- n represents 0, 1 or 2 ;
 - R⁷ and R⁸, which may be the same or different, represent H, substituted or non-substituted C₁-C₆-alkyl ;
 - R⁷ and R⁸ may form a heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ;
 - R⁹ represents H, substituted or non-substituted, linear or branched C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkenyl, C₁-C₈-alkinyl ;
 - R¹⁰ represents H, substituted or non-substituted, linear or branched C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, NR⁷R⁸ ;
 - R¹¹ represents H, substituted or non-substituted, linear or branched C₁-C₈-alkyl, C₁-C₄-alkyl-phenyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₄-alkyl-phenyl, substituted or non-substituted phenyl ;
 - R⁹ and R¹¹ may form a heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ;
 - m represents 1, 2, 3, 4, 5.
2. A compound of formula (I) according to claim 1 wherein
- R¹ represents H, C₁-C₁₂-alkyl or SH ; or
 - R² represents methyl ; or
 - R³ represents C₂-C₁₂-alkyl, C₂-C₁₂-alkenyl, C₃-C₆-cycloalkyl ; or
 - R² and R³ can form together a substituted or non substituted 5 to 7-membered heterocycle ; or
 - R⁴ represents C₁-C₁₂-alkyl, a halogen atom or trifluoromethyl ; or
 - R⁵ represents H, C₁-C₁₂-alkyl, a halogen atom or trifluoromethyl ; or
 - R⁵ which may be the same or different, represents H ; F, Cl, Br, I ; nitro ; cyano ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₄-alkyl-phenyl which may be non substituted or substituted by halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl ; phenyl which may be non substituted or substituted by halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl ; C₁-C₆-alkoxy ; C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl ; C₁-C₆-alkylthio ; C₁-C₆-halogenoalkyl ; C₁-C₆-halogenalkoxy ; C₁-C₆-halogenoalkylthio ; C₁-C₆-alkoxy ; C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl ; C₁-C₆-alkylthio ; benzyloxy which may be non substituted or substituted by halogen ; phenoxy which may be non substituted or substituted by a halogen atom or CF₃ ; NR⁷R⁸ ; C₁-C₄-alkyl-NR⁷R⁸ ; S(O)_nR⁹ ; C₁-C₄-alkyl-S(O)_nR⁹ ; OR¹⁰ ; C₁-C₄-alkyl-COR¹⁰ ; -CR⁹=N-O-R¹¹ ; or
 - two substituents R⁶ may form a carbocyclic or heterocyclic ring, which may comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S ; or
 - R⁷ and R⁸, which may be the same or different, represent H, C₁-C₆ alkyl which may be the same or different ; or

- 50
- R^7 and R^8 may form a heterocyclic ring comprising further heteroatoms selected in the list consisting of O, S, N ; or
 - R^9 represents H, methyl or ethyl ; or
 - R^{10} represents H, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy or NR^7R^8 ; or
 - 5 • R^{11} represents H ; C_1 - C_4 -alkyl ; C_1 - C_4 -halogenoalkyl ; C_1 - C_4 -alkyl-phenyl wherein phenyl may substituted by F, Cl, Br, I, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy ; C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl ; phenoxy ; benzyloxy ; or
 - R^9 and R^{11} may form a 5- or 6-membered heterocyclic ring comprising a further heteroatoms selected in the list consisting of O, S, N ; or
 - 10 • m represents 1, 2, 3 or 4.
3. A compound of formula (I) according to claims 1 or 2 wherein
- R^1 represents C_1 - C_{12} -alkyl ; or
 - R^3 represents a non substituted C_2 - C_4 -alkyl, C_3 - C_4 -alkenyl or cyclopropyl ; or
 - 15 • R^2 and R^3 can form together a 6-membered heterocycle ; or
 - R^4 represents a non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a fluorine or a chlorine atom ; or
 - R^5 represents a non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a fluorine or a chlorine atom ; or
 - m represents 1, 2 or 3.
- 20 4. A compound of formula (I) according to claims 1 to 3 wherein
- R^1 represents methyl ; or
 - R^3 represents ethyl, n-propyl, i-propyl propenyl or allyl ; or
 - R^2 and R^3 can form together a piperidinyl or a pyrrolidinyl ; or
 - R^4 represents methyl or ethyl ; or
 - 25 • R^5 represents methyl or ethyl.
5. A compound of formula (I) according to claims 1 to 4 wherein R^2 and R^3 form together a 2-alkylated-pyrrolidinyl.
- 30 6. A compound of formula (I) according to claim 5 wherein R^2 and R^3 form together a 2-methyl-pyrrolidinyl.
7. A process for the preparation of a compound of formula (I) according to claims 1 to 6 comprising the following steps:



8. A method for controlling phytopathogenic fungi of crops, characterized in that an agronomically effective and substantially non-phytotoxic quantity of a compound according to claims 1 to 6 is applied to the soil where plants grow or are capable of growing, to the leaves or the fruit of plants or to the seeds of plants.
9. A method method for controlling damaging insects characterised in that a compound of formula (I) according to claims 1 to 6 is applied to the seed, the plant or to the fruit of the plant or to the soil wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.



DERIVADOS PLAGUICIDAS DE BIFENILAMIDINA

DESCRIPCIÓN

La presente invención se refiere a derivados de bifenilamidina, a su procedimiento de preparación, su uso como agentes activos fungicidas o insecticidas, particularmente en la forma de composiciones fungicidas o insecticidas, y a métodos para el control de hongos fitopatógenos o insectos dañinos, usando estos compuestos o composiciones.

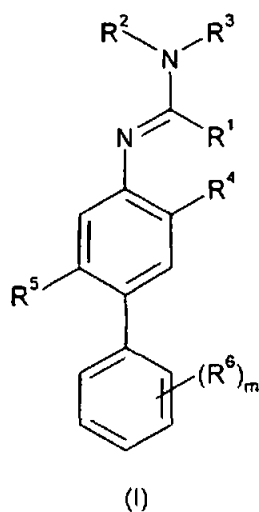
En la solicitud de patente internacional WO-00/46184 se describen varios derivados de fenilamidina. Sin embargo, este documento no describe o sugiere específicamente seleccionar tales compuestos en los que el anillo de fenilo está sustituido de acuerdo con la invención, permitiendo así una actividad fungicida inesperadamente y significativamente mayor.

Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura, el uso de nuevos compuestos plaguicidas con objeto de evitar o luchar contra el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos. Es también de gran interés el uso de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con el objeto de reducir las cantidades de compuesto activo que ha de usar el agricultor, mientras que al mismo tiempo se mantiene una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos.

Del mismo modo, siempre es de gran interés el uso de nuevos agentes insecticidas, nematocidas o acaricidas con el objeto de controlar insectos dañinos u otros organismos dañinos.

Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o ventajas anteriormente mencionados.

Por consiguiente, la presente invención provee derivados de bifenilamidina de fórmula (I):



en la que

- R^1 representa H, un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un alquenilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un alquinilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, SH o un S-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido;
- 5 • R^2 representa un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido;
- R^3 representa un alquilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C_3-C_6 sustituido o no sustituido, un alquenilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un alquinilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, halógeno-alquilo C_1-C_{12} ; o
- 10 • R^1 y R^2 , R^1 y R^3 o R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo de 5 a 7 miembros sustituido o no sustituido;
- R^4 representa un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un átomo de halógeno, halógeno-alquilo C_1-C_{12} , O-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido o ciano;
- m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- R^5 representa un H, un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un átomo de halógeno, halógeno-alquilo C_1-C_{12} , O-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido o ciano;
- 15 • R^6 , que puede ser igual o diferente, representa H, un átomo de halógeno, nitro, ciano; trialquilsililo, alquilo C_1-C_8 , alquil C_1-C_4 sustituido o no sustituido-fenilo, fenilo sustituido o no sustituido, alcoxi C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_8 , halógeno-alquilo C_1-C_6 , halógeno-alcoxi C_1-C_6 o halógeno-alquiltio C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 sustituido o no sustituido-fenilo como benciloxi, fenoxi sustituido o no sustituido, alquilamino C_1-C_8 - NR^7R^8 sustituido, no sustituido, NR^7R^8 sustituido o no sustituido, alquil C_1-C_8 - $S(O)_nR^9$, - $S(O)_nR^9$, alquil C_1-C_8 - $SO_2NR^7R^8$, - $SO_2NR^7R^8$, alquil C_1-C_8 - $C(O)R^{10}$, - $CR^9=N-O-R^{11}$;
- 20 • dos sustituyentes R^6 pueden formar un anillo carbocíclico o heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista de O, N, S;
- 25 • n representa 0, 1 ó 2;
- R^7 y R^8 , que pueden ser iguales o diferentes, representan H, alquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido;
- R^7 y R^8 pueden formar un anillo heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S;
- 30 • R^9 representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado sustituido o no sustituido, alquenilo C_1-C_8 , alquinilo C_1-C_8 ;
- R^{10} representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado sustituido o no sustituido, alcoxi C_1-C_8 , NR^7R^8 ;
- R^{11} representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado sustituido o no sustituido, alquil C_1-C_4 -fenilo, alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alquilo C_1-C_4 sustituido o no sustituido-fenilo, fenilo sustituido o no sustituido;
- 35 • R^9 y R^{11} pueden formar un anillo heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S;

como también sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides e isómeros ópticamente activos o geométricos.

5 Cualquiera de los compuestos según la invención puede existir en una o más formas de isómeros ópticos, geométricos o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos en el compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros ópticos y a sus mezclas racémicas o escalémicas (el término escalémico denota una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones), y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Pueden separarse los diaestereoisómeros y/o los isómeros ópticos de
10 acuerdo con los métodos que son conocidos *per se* por el hombre con experiencia ordinaria en la técnica.

Cualquiera de los compuestos según la invención puede existir también en una o más formas de isómeros geométricos, dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las posibles
15 mezclas, en todas las proporciones. Pueden separarse los isómeros geométricos de acuerdo con métodos generales, que son conocidos *per se* por el hombre con experiencia ordinaria en la técnica.

20 Para los compuestos según la invención, halógeno significa uno de flúor, bromo, cloro o yodo y heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre.

Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R¹ representa H; alquilo C₁-C₁₂, preferiblemente alquilo C₁-C₁₂ como metilo; o SH.

25 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R² representa metilo.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R³ representa alquilo C₂-C₁₂, preferiblemente un alquilo C₂-C₄ no sustituido como etilo, n-propilo, i-propilo; alqueno C₂-C₁₂, preferiblemente alqueno C₃-C₄ como propeno o alilo; cicloalquilo C₃-C₈ como ciclopropilo.
30

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R² y R³ pueden formar juntos un heterociclo sustituido o no sustituido de 5 a 7 miembros, preferiblemente un heterociclo de 6 miembros, más preferiblemente un piridinilo o un
35 pirolidinilo, incluso más preferiblemente un pirolidinilo 2-alquilado como 2-metil-pirolidinilo.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^4 representa alquilo C_1-C_{12} , preferiblemente un alquilo C_1-C_{12} no sustituido como metilo y etilo; un átomo de halógeno como un flúor y un átomo de cloro; trifluorometilo.

- 5 Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^5 representa un H, alquilo C_1-C_{12} , preferiblemente un alquilo C_1-C_{12} sin sustituir como metilo y etilo; un átomo de halógeno como un flúor y un átomo de cloro; trifluorometilo.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que m representa 1, 2, 3 ó 4; incluso más preferiblemente, m representa 1, 2 ó 3.

10

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^6 , que puede ser igual o diferente, representa H; F, Cl, Br, I; nitro; ciano; alquilo C_1-C_6 ; alquil C_1-C_4 -fenilo que puede no estar sustituido o estar sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógeno-alquilo C_1-C_4 ; fenilo que puede no estar sustituido o estar sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógeno-alquilo C_1-C_4 ; alcoxi C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ; alquiltio C_1-C_6 ; halógeno-alquilo C_1-C_6 ; halógeno-alquilo C_1-C_6 ; halógeno-alquiltio C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ; alquiltio C_1-C_6 ; benciloxi que puede no estar sustituido o estar sustituido con halógeno; fenoxi que puede no estar sustituido o estar sustituido con un átomo de halógeno o CF_3 ; NR^7R^8 ; alquilo C_1-C_4 - NR^7R^8 ; $S(O)_nR^9$; alquilo C_1-C_4 - $S(O)_nR^9$; OR^{10} ; alquilo C_1-C_4 - COR^{10} ; $-CR^9=N-O-R^{11}$.

20

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^7 y R^8 , que pueden ser iguales o diferentes, representan H, alquilo C_1-C_6 o R^7 y R^8 pueden formar un anillo heterocíclico que comprende otros heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, S, N.

25

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^9 representa H, metilo o etilo.

- 30 Incluso otros compuestos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{10} representa H; alquilo C_1-C_4 ; alcoxi C_1-C_4 ; NR^7R^8 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{11} representa H; alquilo C_1-C_4 ; halógeno-alquilo C_1-C_4 ; alquil C_1-C_4 -fenilo en el que el fenilo puede estar sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ; fenoxi; benciloxi.

35

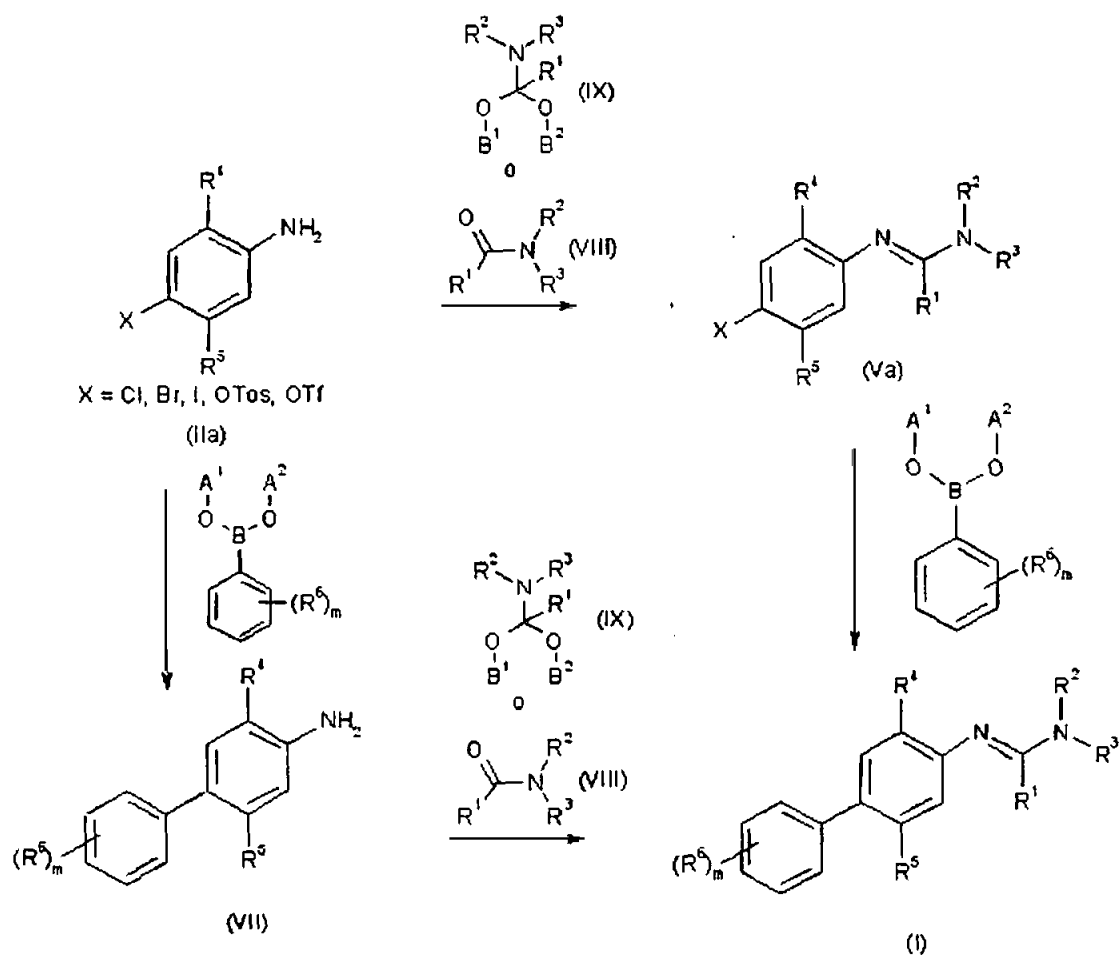
Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R⁹ y R¹¹ pueden formar un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que comprende otros heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, S, N.

5 Las preferencias anteriormente mencionadas con relación a los sustituyentes de los compuestos según la invención pueden combinarse de varias formas. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan así subclases de compuestos según la invención. Ejemplos de tales subclases de compuestos preferidos según la invención pueden combinar:

- 10 - características preferidas de R¹ con características preferidas de R² a R⁶ o a R¹¹, si corresponde;
- características preferidas de R² con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹¹, si corresponde;
- características preferidas de R³ con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹¹, si corresponde;
- 15 - características preferidas de R⁴ con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹¹, si corresponde;
- características preferidas de R⁵ con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹¹, si corresponde.

20 En estas combinaciones de características preferidas de los sustituyentes de los compuestos según la invención, dichas características preferidas también se pueden seleccionar entre las características más preferidas de m, n y R¹ a R¹¹ como para formar las subclases más preferidas de los compuestos según la invención.

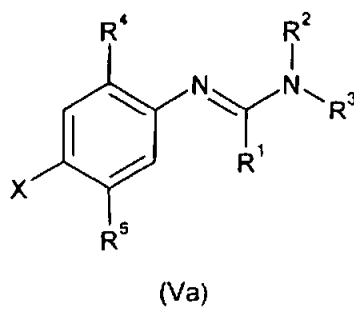
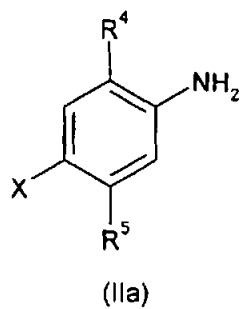
25 La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I). En general, la preparación del compuesto de fórmula (I) de según la invención se puede llevar a cabo tal como se ilustra en el esquema 1.



Esquema 1

Por lo tanto, de acuerdo con otro aspecto según la invención, se provee un procedimiento (a) para la preparación de derivados de anilina de fórmulas (I) o (VII), haciendo reaccionar los

5 derivados de anilina de fórmulas (IIa) o (Va)

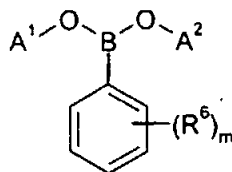


en la que

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son tal como se definen en la presente memoria y
- X representa halógeno, tosilato, SOME, mesilato o triflato;

con un derivado de ácido bórico de fórmula (IV)

5



(IV)

en la que

- m y R^6 son tal como se definen en la presente memoria;
- A^1 y A^2 representan cada uno hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno.

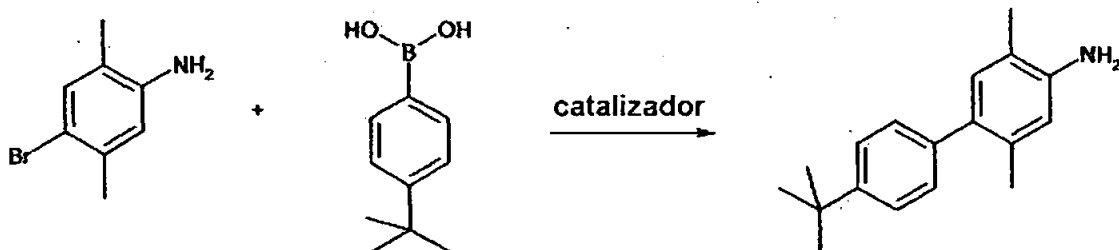
10

El procedimiento (a) de acuerdo con la invención puede además comprender una o más de las siguientes características:

- presencia de un ligante ácido;
- presencia de un diluyente orgánico inerte;
- presencia de un catalizador.

15

El procedimiento (a) según la invención se lleva a cabo usando 2,3-dimetil-4-bromo-anilina y ácido 4-terc-butil-fenil-bórico como materiales de inicio y un catalizador. El procedimiento (a) se puede llevar a cabo según el esquema 2:



20

Esquema 2

Para llevar a cabo el procedimiento (a) según la invención, se utilizan derivados de anilina o amidina de fórmulas (IIa) o (Va) respectivamente como materiales de partida.

25

Los materiales de partida preferidos para el procedimiento (a) según la invención son compuestos de fórmulas (IIa) o (Va) en las que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 representan sustituyentes tal como se definen en la presente memoria para el compuesto preferido de fórmula (I) según la invención.

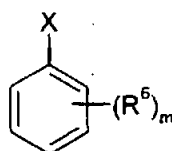
30

X representa halógeno, triflato, SOME, mesilato, tosilato.

Se conocen los derivados de anilina de fórmula (IIa) y los derivados de ácido bórico de fórmula (IV), como también el procedimiento respectivo para su preparación.

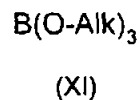
- 5 La fórmula (IV) provee una definición general de los derivados de ácido bórico adicionalmente requeridos como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (a) según la invención. En la fórmula (IV), R^6 y m representan preferiblemente sustituyentes que ya han sido descritos como preferidos en relación con el compuesto de fórmula (I), A^1 y A^2 preferiblemente representan cada uno hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno para el compuesto de
- 10 fórmula (IV).

- Los derivados de ácido bórico de fórmula (IV) se conocen y se pueden preparar por procedimientos conocidos, por ejemplo los descritos en las publicaciones internacionales WO-01/90084 o US-5.633.218. Estos derivados se pueden obtener, por ejemplo, haciendo
- 15 reaccionar un derivado de fenilo de fórmula (VI)



(VI)

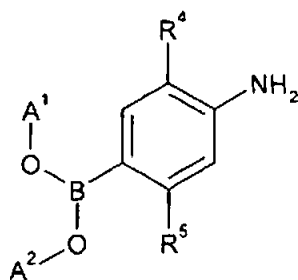
- en la que R^6 y m son tal como se definen en la presente memoria, X representa halógeno, triflato, SOMe, mesilato, tosilato; con ésteres de ácido bórico de fórmula (XI)
- 20



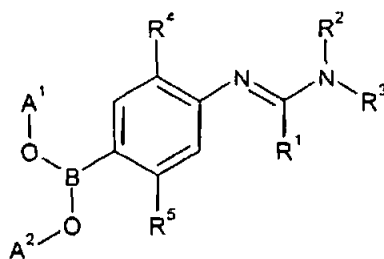
- en la que Alk representa alquilo C_1-C_4 ; o con 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano; en presencia de magnesio o alquil-litio. Se puede utilizar un diluyente como tetrahidrofurano.
- 25

- La fórmula (XI) provee una definición general de los ésteres de ácido bórico que se pueden utilizar para preparar derivados de ácido bórico de fórmula (IV) según la invención. En la fórmula (XI), Alq preferiblemente representa metilo, etilo, n- o iso-propilo, más preferiblemente metilo o etilo. Los ésteres de ácido bórico de fórmula (XI) son compuestos conocidos.
- 30

Otro aspecto según la invención reside en un procedimiento (b) para la preparación de derivados de anilina de fórmulas (I) o (VII), haciendo reaccionar derivados de ácido bórico de fórmulas (IIb) o (Vb)



(IIb)



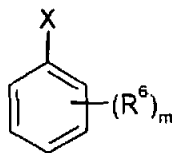
(Vb)

5

en la que

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son tal como se definen en la presente memoria y
- A^1 y A^2 representan cada uno hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno;

con derivados de fenilo de fórmula (VI)



(VI)

10

en la que

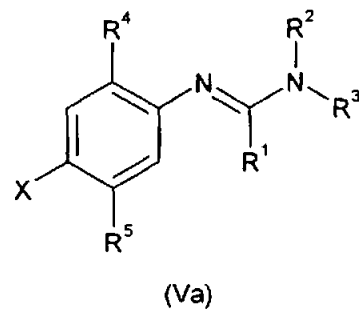
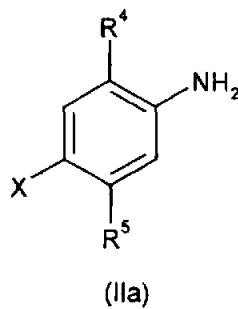
- R^6 y m son tal como se definen en la presente memoria;
- X representa halógeno, triflato, SOMe, mesilato, tosilato.

15 El procedimiento (b) según la invención puede comprender además una o más de las siguientes características:

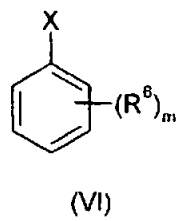
- presencia de un ligante ácido;
- presencia de un diluyente orgánico inerte;
- presencia de un catalizador.

20

Otro aspecto según la invención reside en un procedimiento (c) para la preparación de derivados de anilina de fórmulas (I) o (VII), haciendo reaccionar derivados de anilina de fórmulas (IIa) o (Va)



- 5 en la que
- R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son tal como se definen en la presente memoria y
 - X representa halógeno, triflato, SOME, mesilato, tosilato;
- con derivados de fenilo de la fórmula (VI)



- 10 en la que
- R⁶ y m son tal como se definen en la presente memoria;
 - X representa halógeno, triflato, SOME, mesilato, tosilato;
- en presencia de un catalizador de paladio, níquel o platino y en presencia de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano.
- 15

El procedimiento (c) según la invención puede comprender además una o más de las siguientes características:

- presencia de un ligante ácido;
 - presencia de un diluyente orgánico inerte.
- 20

Las fórmulas (IIa) y (Va) proveen definiciones generales de los derivados de amina sustituida útiles como componentes de reacción para llevar a cabo los procedimientos (a) o (c) según la

invención. En estas fórmulas, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 preferiblemente representan sustituyentes tal como se definen en la presente memoria con relación a la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

Halógeno preferiblemente representa cloro, bromo o yodo, más preferiblemente bromo o yodo.

5

Los derivados de anilina de fórmula (II) son compuestos conocidos y se pueden preparar por métodos conocidos a partir de los compuestos nitro correspondientes por reducción o por halogenación de los derivados de anilina correspondientes.

- 10 Los derivados de ácido bórico de fórmula (IV) que se pueden utilizar como materiales de partida para llevar a cabo los procedimientos (a) según la invención son reactivos conocidos o existentes en el mercado.

- 15 Las fórmulas (IIb) y (Vb) proveen definiciones generales de los derivados de ácido bórico útiles como componentes de reacción para llevar a cabo el procedimiento (b) según la invención. En estas fórmulas, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 preferiblemente representan sustituyentes tal como se definen en la presente memoria con relación a la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención. A^1 y A^2 preferiblemente representan cada uno hidrógeno o juntos representan tetrametilileno.

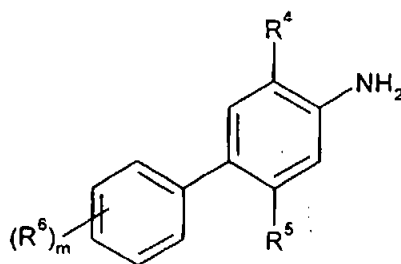
20

Los derivados de ácido bórico de fórmula (IIb), (Vb) o los derivados de fenilo de fórmula (VI) se conocen y se pueden preparar por métodos conocidos.

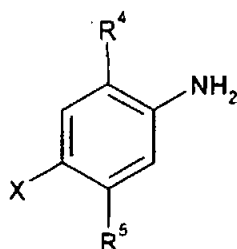
- 25 Los derivados de amidina de fórmulas (I) y (Va) se pueden obtener mediante un procedimiento adicional según la invención. Pueden considerarse varias alternativas del procedimiento (d) según la invención, se definen como procedimiento (d1), procedimiento (d2) y procedimiento (d3) según la invención.

El procedimiento (d) según la invención comprende hacer reaccionar derivados de anilina de fórmulas (VII) o (IIa) con diferentes reactivos, definiendo así los procedimientos (d1), (d2) y (d3)

- 30 respectivamente



(VII)

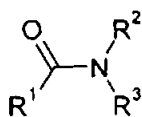


(IIa)

en la que

- R^4 , R^5 , R^6 y m son tal como se definen en la presente memoria;
- X representa halógeno, triflato, SOME, mesilato o tosilato.

El procedimiento (d1) se lleva a cabo también usando derivados de amida de fórmula (VIII)



(VIII)

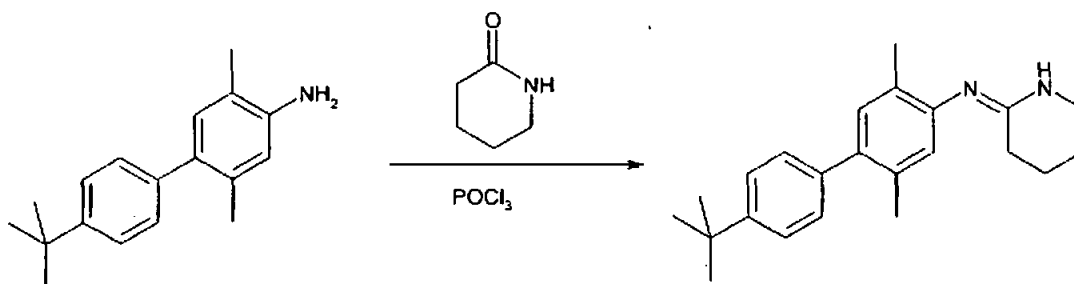
en la que

- R^1 , R^2 , R^3 son tal como se definen en la presente memoria.

El procedimiento (b) según la invención puede comprender además una o más de las siguientes características:

- presencia de un agente de halogenación como PCl_5 , PCl_3 , $POCl_3$, $SOCl_2$;
- presencia de un diluyente.

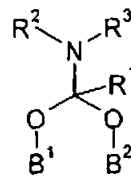
El procedimiento (d1) según la invención se lleva a cabo usando 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina, piperidin-2-ona y tricloruro fosfórico, como materiales de partida, y un ácido. El procedimiento (d1) se puede llevar a cabo según el esquema 3.

Esquema 3

La fórmula (VII) provee una definición general de las bifenilaminas útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (d1) según la invención. En esta fórmula, R^1 , R^2 , R^3 ,

R^4 , R^5 , R^6 y m preferiblemente representan sustituyentes o valores tal como se define en la presente con relación a la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

El procedimiento (d2) se lleva a cabo además usando derivados de amino-acetal de fórmula (IX)



(IX)

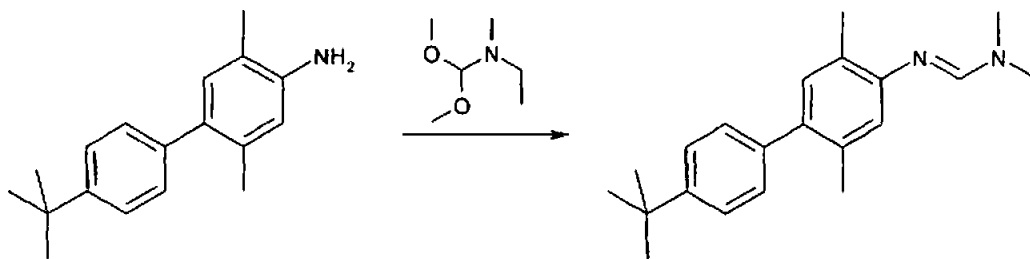
en la que

- R^1 , R^2 , R^3 son tal como se define en la presente memoria;
- B^1 y B^2 representan cada uno alquilo o juntos cicloalquilo.

El procedimiento (d2) según la invención puede comprender además una o más de las siguientes características:

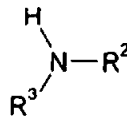
- presencia de un ácido o base;
- presencia de un diluyente.

El procedimiento (d2) según la invención se lleva a cabo usando 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina y N-(dimetoximetil)-N-metiletanamina como materiales de partida. El procedimiento (d2) se puede llevar a cabo según el esquema 4.



Esquema 4

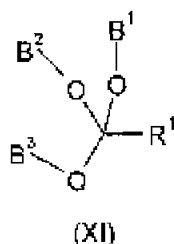
El procedimiento (d3) se lleva a cabo usando derivados de amina de fórmula (X)



(X)

en la que

- R^2 y R^3 son tal como se definen en la presente memoria;
- en presencia de derivados de ortoéster de fórmula (XI)

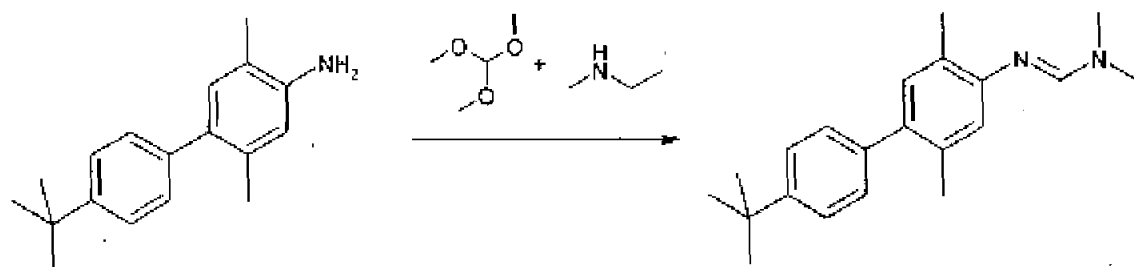


en la que

- R¹ es como se define en la presente memoria;
- B¹, B² y B³ representan cada uno alquilo.

La fórmula (VII) provee una definición general de las bifenilaminas útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (d3) según la invención. En esta fórmula, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m preferiblemente representan sustituyentes o valores tal como se define en la presente en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

El procedimiento (d3) según la invención se lleva a cabo usando 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina, trimetil-orto-éster y N-metil-etanamina, como materiales de partida, y un ácido. El procedimiento (d3) se puede llevar a cabo según el esquema 5.



Esquema 5

La fórmula (VII) provee una definición general de las bifenilaminas útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (d3) según la invención. En esta fórmula, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m preferiblemente representan sustituyentes o valores tal como se definen en la presente memoria con relación a la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

Los procedimientos (d), (d1), (d2) o (d3) según la invención comprenden también una o más de las siguientes características:

- presencia de un ácido o base;
- presencia de un diluyente.

Los diluyentes adecuados para realizar los procedimientos (a), (b) y (c) según la invención son todos los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso de hidrocarburos

alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalino; hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butilico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o iso-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida hexametilfosfórica; sus mezclas con agua o agua pura.

- 10 Los diluyentes adecuados para realizar los procedimientos (d1), (d2) y (d3) según la invención son en cada caso todos los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso de hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalin; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butilico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o iso-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida hexametilfosfórica; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo; o sulfonas, tales como sulfolano; alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o iso-propanol, n-, iso-, sec- o terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter; sus mezclas con agua o agua pura.

- Los ligantes ácidos adecuados para realizar los procedimientos (a), (b) y (c) según la invención son todas las bases orgánicas e inorgánicas habituales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de metal alcalino térreo o hidruros de metal alcalino, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrógeno carbonatos, como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

- 35 Los ligantes ácidos adecuados para realizar los procedimientos (b), (c) y (d) según la invención son todas las bases orgánicas e inorgánicas habituales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de hidruros de metal alcalino o metal alcalino térreo, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, fluoruros, fosfatos, carbonatos o hidrógeno carbonatos, tales como hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de sodio, metanolato de sodio, etanolato de

sodio, terc-butanolato de sodio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de hidrógeno de potasio, carbonato de hidrógeno de sodio o carbonato de cesio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, 5 tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

Los ácidos adecuados para llevar a cabo el procedimiento (d3) según la invención son todos 10 ácidos inorgánicos u orgánicos habituales para dichas reacciones. Se da preferencia al uso de ácido para-tolueno sulfónico, ácido metanosulfónico, ácido clorhídrico (disolución gaseosa, acuosa u orgánica) o ácido sulfúrico.

Los agentes de condensación adecuados para llevar a cabo el procedimiento (d1) según la 15 invención son todos agentes de condensación habituales para dichas reacciones de amidación. Se da preferencia al uso de formador de haluro de ácido, como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; formador de anhídrido, como cloroformato de etilo, cloroformato de metilo, cloroformato de isopropilo, cloroformato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como 20 N,N'-díciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensadores habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, o bromo-tripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato.

25 Los procedimientos (a), (b) y (c) de la invención se pueden llevar a cabo en presencia de un catalizador. Se da preferencia a sales o complejos de paladio, como cloruro de paladio, acetato de paladio, tetrakis-(trifenilfosfina) paladio, dicloruro de bis-(trifenilfosfina) paladio o cloruro de 1,1'-Bis(difenilfosfino)ferrocenopaladio (II).

También es posible generar un complejo de paladio directamente en la mezcla de reacción 30 añadiendo separadamente a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo, como trietilfosfano, tri-terc-butilfosfano, triciclohexilfosfano, 2-(díciclohexilfosfano)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfan)bifenilo, 2-(díciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfano, tris-(o-tolil)fosfano, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfano, 2,2'-bis-(difenilfosfano)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfano)butano, 1,2-bis-(difenilfosfano)etano, 1,4- 35 bis-(díciclohexilfosfano)butano, 1,2-bis-(díciclohexilfosfano)etano, 2-(díciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno o tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito.

Cuando se lleva cabo el procedimiento (d) según la invención, la temperatura de reacción puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, el procedimiento se lleva

a cabo a temperaturas entre 0°C y 150°C, preferiblemente entre 0°C y 120°C, particularmente entre 10°C y 90°C.

Cuando se llevan a cabo los procedimientos (a), (b) según la invención, las temperaturas de reacción pueden, en cada caso, variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, el procedimiento se lleva a cabo a temperaturas entre 0°C y 180°C, preferiblemente entre 10°C y 150°C, particularmente entre 20°C y 120°C.

Cuando se lleva a cabo el procedimiento (a) según la invención, en general se emplean entre 0,5 y 15 mol, preferiblemente entre 0,8 y 8 mol, de derivado de ácido bórico de la fórmula (IV) y entre 1 y 5 mol de ligante ácido y entre 0,2 y 5% mol de catalizador por mol de amina o amidina de la fórmula (IIa) o (Va). No obstante, también es posible emplear los componentes de reacción en otras relaciones. El tratamiento final se lleva a cabo por métodos habituales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y el precipitado se separa y se seca. Al residuo que permanece, si corresponde, se le pueden quitar impurezas que aún pueden estar presentes usando métodos habituales, como cromatografía o recristalización.

Cuando se lleva a cabo el procedimiento (b) según la invención, en general se emplean entre 0,8 y 15 mol, preferiblemente entre 0,8 y 8 mol, de derivado de fenilo de la fórmula (VI) y entre 1 y 10 mol de ligante ácido y entre 0,5 y 5% mol de un catalizador por mol de derivado de ácido bórico de la fórmula (IIb) o (Vb). No obstante, también es posible emplear los componentes de reacción en otras relaciones. El tratamiento final se lleva a cabo por métodos habituales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y el precipitado se separa y se seca. Al residuo que permanece, si corresponde, se le pueden quitar impurezas que aún pueden estar presentes usando métodos habituales, como cromatografía o recristalización.

Cuando se lleva a cabo el procedimiento (c) según la invención, en general se emplean entre 0,8 y 15 mol, preferiblemente entre 0,8 y 8 mol, de amina o derivado de amidina de la fórmula (IIa) o (Va) y entre 0,8 y 15 mol, preferiblemente entre 0,8 y 8 mol, de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano y entre 1 y 5 mol de ligante ácido y entre 1 y 5 mol de un catalizador por mol de derivado de fenilo de la fórmula (VI). No obstante, también es posible emplear los componentes de reacción en otras relaciones. El tratamiento final se lleva a cabo por métodos habituales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y el precipitado se separa y se seca. Al residuo que permanece, si corresponde, se le pueden quitar impurezas que aún pueden estar presentes usando métodos habituales, como cromatografía o recristalización.

Cuando se lleva a cabo el procedimiento (d1) según la invención, se emplean, por mol de la amina de la fórmula (VII) o (Va), en general entre 0,8 y 50 mol, preferiblemente entre 1 y 10 mol de amida de la fórmula (VIII) y entre 1 y 10 mol de agente de halogenación. No obstante,

también es posible emplear los componentes de reacción en otras relaciones. El tratamiento final se lleva a cabo por métodos habituales.

5 Cuando se lleva a cabo el procedimiento (d2) según la invención se emplean, por mol de la amina de la fórmula (VII) o (Va), en general entre 0,8 y 50 mol, preferiblemente entre 1 y 10 mol de un aminoacetal de la fórmula (IX). No obstante, también es posible emplear los componentes de reacción en otras relaciones. El tratamiento final se lleva a cabo por métodos habituales.

10 Cuando se lleva a cabo el procedimiento (d3) según la invención, se emplean, por mol de la amina de la fórmula (VII) o (Va), en general entre 0,8 y 50 mol, preferiblemente entre 1 y 10 mol de un ortoéster de la fórmula (XI) y 0,8 a 50 mol, preferiblemente entre 1 y 10 mol de una amina de la fórmula (X) y una cantidad catalítica de ácido. No obstante, también es posible emplear los componentes de reacción en otras relaciones. El tratamiento final se lleva a cabo
15 por métodos habituales.

Todos los procedimientos de acuerdo con la invención en general se llevan a cabo a presión atmosférica. No obstante, en cada caso también es posible operar a presión elevada o reducida, en general entre 0,1 bar y 10 bar.

20

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

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

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

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

Por lo tanto, según la invención, se provee una composición fungicida o insecticida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) tal

como se define en la presente y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

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

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

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

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

Las composiciones conformes a la presente invención se pueden usar en diversas formas tales como dispensador de aerosol, cebo (listo para usar), concentrado de cebo, bloque de cebo, suspensión en cápsulas, concentrado para fumigación en frío, polvo fino para espolvorear, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, granulado encapsulado, granulado fino, concentrado fluido para el tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, cebo en granos, cebo granulado, granulado, concentrado para fumigación en caliente, macrogranulados, microgranulados, polvo dispersable en aceite, concentrado fluido miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, bastoncillos, cebo en

láminas, polvo para tratamiento de semillas en seco, fragmentos de cebo, semillas revestidas con un plaguicida, bote de humo, cartucho de humo, generador de humo, cilindro de humo, bastoncillos de humo, pastilla de humo, lata de humo, concentrado soluble, polvo soluble, disolución para el tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluido),
 5 polvo de rastreo, líquido de muy bajo volumen (ulv), suspensión de muy bajo volumen (ulv), producto que libera vapor, granulados o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, granulados o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humectable.

Estas composiciones incluyen no sólo composiciones que están listas para ser aplicadas a la
 10 planta o semilla que se tenga que tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo pulverizador o de aplicación de polvo fino, sino también las composiciones concentradas comerciales que han de diluirse antes de la aplicación al cultivo.

Los compuestos según la invención pueden mezclarse también con una o más sustancias activas
 15 insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen un espectro de actividad más amplio.

Las mezclas con otros compuestos fungicidas son particularmente ventajosas. Ejemplos de
 compañeros fungicidas de mezcla adecuados pueden seleccionarse de las siguientes listas:

20 B1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis del ácido nucleico como benalaxilo, benalaxilo-M, bupirinato, quiralaxilo, clozilacón, dimétirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolinico;

B2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y división celular como benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida;

25 B3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo

como inhibidor de la respiración-CI como diflometorim;

como inhibidor de la respiración CII como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida;

30 como inhibidor de la respiración CIII como azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina;

B4) un compuesto capaz de actuar como desacoplador como dinocap, fluazinam;

B5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP como acetato de fentin, cloruro de fentin, hidróxido de fentin, siltiofam;

5 B6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de AA y proteínas como andoprim, blastidina-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina hidratada, mepanipirim, pirimetanil;

B7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señal como fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen;

10 B8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membranas como clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotiolano, tolclofos-metilo, bifenilo, yodocarb, propamocarb, propamocarb-hidrocloreto;

15 B9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol como fenhexamida, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

20 B10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de la pared celular como bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A;

B11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina como carpropamid, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilon, triciclazol;

25 B12) un compuesto capaz de inducir una defensa del hospedador como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil;

30 B13) un compuesto capaz de tener una acción multi-sitio como captafol, captan, clorotalonil, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, mezcla Bordeaux y oxina-cobre, diclofluanid, ditianon, dodina, base libre dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram;

- B14) un compuesto seleccionado de la siguiente lista: amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicin, carvona, quinometionato, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofen, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilinona, oxamocarb, oxifentiin, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalina, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclamida, zarilamid y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-Cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 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-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, 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 metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-.alfa.-(metoximetileno)-bencenoacetato de metilo, 4-Cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-1,2,4-triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil]-1,2,4-triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)-1,2,4-triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3(1Fluoro-2-fenilet)il]oxi]fenil]etilideno]amino]oxi]metil]-.alfa.-(metoxiimino)-N-metil-.alfaE-bencenoacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico.

La composición según la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida puede ser también particularmente ventajosa. Ejemplos de compañeros bactericidas de mezcla adecuados pueden seleccionarse de la siguiente lista: bronopol, diclorofen, nitrapirin, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

El compuesto de fórmula (I) y la composición fungicida según la invención pueden usarse para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatógenos de las plantas o de los cultivos. Por lo tanto, de acuerdo con otro aspecto de la invención, se provee un método para controlar, en forma curativa o preventiva, los hongos fitopatógenos de plantas o cultivos caracterizado porque se aplica un compuesto de fórmula (I) o una composición fungicida según la invención a la semilla o a la fruta de la planta o al suelo en el que crece o se desea que crezca la planta.

Del mismo modo, el compuesto de fórmula (I) y la composición insecticida según la invención pueden usarse para combatir de forma curativa o preventiva los insectos dañinos, en especial de las plantas o de los cultivos. Por lo tanto, de acuerdo con otro aspecto de la invención, se provee un método para controlar, en forma curativa o preventiva, los insectos dañinos, en especial de plantas o cultivos, caracterizado porque se aplica un compuesto de fórmula (I) o una composición insecticida según la invención a la semilla, la planta o a la fruta de la planta o al suelo en el que crece o se desea que crezca la planta.

Los métodos de tratamiento según la invención pueden también ser útiles para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o siembras de plántulas y plantas o siembras de plantas. Estos métodos de tratamiento pueden también ser útiles para tratar raíces. Los métodos de tratamiento según la invención también pueden ser útiles para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o vástagos, hojas, flores y frutos de la planta en cuestión.

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

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que se pueden proteger por el método según la invención, se pueden mencionar:

Enfermedades por oídio, tales como:

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

Enfermedades por *Mycosphaerella*, causadas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

Enfermedades por *Phaeosphaeria*, causadas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum*;

Enfermedades por *Pyrenophora*, causadas por ejemplo por *Pyrenophora teres*;

5 Enfermedades por *Ramularia*, provocadas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni*;

Enfermedades por *Rhynchosporium*, causadas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;

Enfermedades por *Septoria*, causadas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;

Enfermedades por *Typhula*, causadas por ejemplo por *Typhula incarnata*;

10 Enfermedades por *Venturia*, causadas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

Enfermedades de la raíz y el tallo, tales como:

Enfermedades por *Corticium*, causadas por ejemplo por *Corticium graminearum*;

Enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

15 Enfermedades por *Gaeumannomyces*, causadas por ejemplo por *Gaeumannomyces graminis*;

Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

Enfermedades por *Tapesia*, causadas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;

Enfermedades por *Thielaviopsis*, causadas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola*;

Enfermedades de la mazorca y de la panícula, tales como:

20 Enfermedades por *Alternaria*, causadas por ejemplo por *Alternaria spp.* ;

Enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

Enfermedades por *Cladosporium*, causadas por ejemplo por *Cladosporium spp.* ;

Enfermedades por *Claviceps*, causadas por ejemplo por *Claviceps purpurea*;

Enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

25 Enfermedades por *Gibberella*, causadas por ejemplo por *Gibberella zeae*;

Enfermedades por *Monographella*, causadas por ejemplo por *Monographella nivalis*;

Enfermedades por Carbón y tizón, tales como:

Enfermedades por *Sphacelotheca*, causadas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana*;

Enfermedades por *Tilletia*, causadas por ejemplo por *Tilletia caries*;

30 Enfermedades por *Urocystis*, causadas por ejemplo por *Urocystis occulta*;

Enfermedades por *Ustilago*, causadas por ejemplo por *Ustilago nuda*;

Enfermedades por moho y roña de la fruta tales como:

Enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

Enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

35 Enfermedades por *Penicillium*, causadas por ejemplo por *Penicillium expansum*;

Enfermedades por *Sclerotinia*, causadas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;

Enfermedades por *Verticillium*, causadas por ejemplo por *Verticillium alboatrum*;

Enfermedades por podredumbre de las semillas y del suelo, moho, marchitez, roña y caída de almáciga:

- Enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;
 Enfermedades por *Phytophthora*, causadas por ejemplo por *Phytophthora cactorum*;
 Enfermedades por *Pythium*, causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;
 Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;
 5 Enfermedades por *Sclerotium*, causadas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;
 Enfermedades por *Microdochium*, causadas por ejemplo por *Microdochium nivale*;
 Enfermedades por cancro, escoba, puntiseco tales como:
 Enfermedades por *Nectria*, causadas por ejemplo por *Nectria galligena*;
 Enfermedades por tizón, tales como :
 10 Enfermedades por *Monilinia*, causadas por ejemplo por *Monilinia laxa*;
 Enfermedades por ampolla de la hoja o encrespamiento de la hoja, tales como :
 Enfermedades por *Taphrina*, causadas por ejemplo por *Taphrina deformans*;
 Enfermedades de deterioro de plantas madereras tales como:
 Enfermedades por Esca, causadas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;
 15 *Eutypa dyebark*, causada por ejemplo por *Eutypa lata*;
 Enfermedad de los olmos holandeses, causada por ejemplo por *Ceratocystis ulmi*;
 Enfermedades de flores y semillas tales como:
 Enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;
 Enfermedades de tubérculos tales como:
 20 Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*.

Entre las plagas o insectos dañinos que se pueden combatir en cualquier etapa de desarrollo según el método insecticida de la invención, se pueden mencionar:

- la clase de *Anoplura* (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp.,
 25 *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.;
- la clase de *Arachnida*, por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp.,
 30 *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*;
- la clase de *Bivalva*, por ejemplo, *Dreissena* spp.;
- la clase de *Chilopoda*, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;
- la clase de *Coleoptera*, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp.,
 35 *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp.,

- Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizophorthera dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternuchus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp..
- la clase de *Collembola*, por ejemplo, *Onychiurus armatus*;
 - la clase de *Dermaptera*, por ejemplo, *Forficula auricularia*;
 - la clase de *Diplopoda*, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*;
 - la clase de *Diptera*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.;
 - la clase de *Gastropoda*, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.;
 - la clase de *helminths*, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*;
 - Protozoos, tales como *Eimeria*;

- la clase de *Heteroptera*, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp.,

5 *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp;
- la clase de *Homoptera*, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp.,

10 *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp.,

15 *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxylus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca*

20 *coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*,

25 *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria pyrifomis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp.,

30 *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Triozia* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*;
- la clase de *Hymenoptera*, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp.,

35 *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.;
- la clase de *Isopoda*, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- la clase de *Isoptera*, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.;

- 5

 - la clase de *Lepidoptera*, por ejemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.;
- 10

 - la clase de *Orthoptera*, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*;
- 15

 - la clase de *Siphonaptera*, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.
 - la clase de *Symphyla*, por ejemplo, *Scutigera* spp.;
- 20

 - la clase de *Thysanoptera*, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.;
- 25

 - la clase de *Thysanura*, por ejemplo, *Lepisma saccharina*;
- 30

 - los nemátodos fitoparasitarios que incluyen por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.;
 - los escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;
- 35

 - *Hymenopterans*, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;
 - termitas, tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santoniensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

- *Bristletails*, tales como *Lepisma saccharina*;
- la clase de *Acarina*, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*;
- 5 • la clase de *Araneae*, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*;
- la clase de *Opiliones*, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;
- la clase de *Isopoda*, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- 10 • la clase de *Diplopoda*, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.;
- la clase de *Chilopoda*, por ejemplo, *Geophilus* spp.;
- la clase de *Zygentoma*, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*;
- 15 • la clase de *Blattaria*, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*;
- la clase de *Saltatoria*, por ejemplo, *Acheta domesticus*;
- la clase de *Dermaptera*, por ejemplo, *Forficula auricularia*;
- 20 • la clase de *Isoptera*, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticulitermes* spp.;
- la clase de *Psocoptera*, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.;
- la clase de *Coleoptera*, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- 25 • la clase de *Diptera*, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;
- 30 • la clase de *Lepidoptera*, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*;
- la clase de *Siphonaptera*, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- la clase de *Hymenoptera*, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*,
35 *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*;
- la clase de *Anoplura*, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*;

- la clase de *Heteroptera*, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

La composición fungicida o insecticida según la invención puede también utilizarse contra enfermedades fúngicas o insectos dañinos que se desarrollan en la madera o atacan la madera. El término "madera" se refiere a todos los tipos de especies de madera, y a todos los tipos de trabajos de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y contrachapado. El método para tratar la madera según la invención consiste fundamentalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos según la invención, o con una composición según la invención; esto incluye por ejemplo, la aplicación directa, la pulverización, la inmersión, la inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de compuesto activo aplicada normalmente en el método de tratamiento según la invención está general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferiblemente, entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento de las hojas. La dosis de sustancia activa aplicada está general y ventajosamente entre 2 y 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 150 g por 100 kg de semillas en el caso del tratamiento de semillas.

Se entiende claramente que las dosis indicadas en la presente memoria se dan como ejemplos ilustrativos del método según la invención. Un experto en la técnica sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación, especialmente según la naturaleza de la planta o del cultivo a tratar.

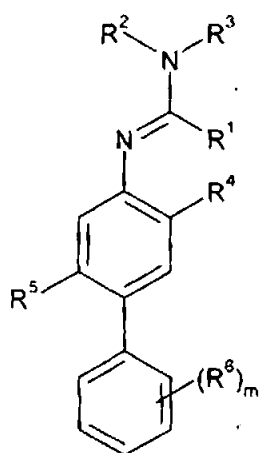
La composición fungicida o insecticida de acuerdo con la invención también puede utilizarse en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos según la invención o las composiciones agroquímicas según la invención. Las plantas modificadas genéticamente son plantas en cuyo genoma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

Los compuestos o mezclas según la invención pueden también utilizarse para la preparación de una composición útil para tratar en forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas en seres humanos o animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, tricofitosis y candidiasis o enfermedades provocadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

Los distintos aspectos de la invención se ilustrarán ahora con referencia a las siguientes tablas de ejemplos de compuestos. Las siguientes tablas ilustran, de una forma no limitativa, ejemplos de compuestos según la presente invención.

En los ejemplos siguientes, M+1 (ó M-1) se refiere al pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica), respectivamente, cuando se observa en espectroscopía de masas y M (Apcl+) se refiere al pico del ión molecular que se encontró por ionización química a presión atmosférica positiva en espectroscopía de masas.

- En los siguientes ejemplos, los valores logP se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C 18), usando el método descrito a continuación:
- 10 Temperatura: 40°C; Fases móviles: Acetonitrilo y ácido fórmico acuoso al 0,1%; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 90% de acetonitrilo.
- La calibración se realizó usando alcan-2-onas sin ramificar (que comprenden de 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (determinación de los valores de logP por los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).
- 15 Los valores máx de lambda se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 190nm a 400nm.



(I)

20

25

Tabla 1:

No.	R1	R2	R3	R1	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
							ortho	meta	para	meta'	
1	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	tBu	H	2,44
2	H	Me	Et	H	CF3	H	H	H	tBu	H	2,83
3	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Cl	F	H	1,92
4	H	Me	Et	H	CF3	H	H	Cl	F	H	2,36
5	H	Me	Et	H	Me	H	H	Cl	F	H	2,00
6	H	Me	Et	H	F	H	H	H	tBu	H	2,20
7	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	tBu	H	2,86
8	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	tBu	H	2,67
9	H	Me	Et	H	F	H	H	Cl	F	H	1,78
10	H	Me	Et	H	Et	H	H	Cl	F	H	2,17
11	H	Me	Et	H	CF3	H	OMe	OMe	OMe	H	1,84
12	H	Me	Et	H	F	H	OMe	OMe	OMe	H	1,50
13	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	F	H	1,69
14	H	Me	Et	H	CF3	H	H	H	F	H	1,93
15	H	Me	Et	H	F	H	H	H	F	H	1,50
16	H	Me	Et	H	Me	H	H	CF3	Cl	H	2,28
17	H	Me	Et	H	Me	Me	H	CF3	Cl	H	2,40
18	H	Me	Et	H	Cl	H	H	CF3	Cl	H	2,19
19	H	Me	Et	H	CF3	H	H	CF3	Cl	H	2,90
20	H	Me	Et	H	F	H	H	CF3	Cl	H	2,15
21	H	Me	Et	H	Et	H	H	CF3	Cl	H	2,39
22	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	F	H	1,95
23	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	F	H	1,79
24	H	Me	Et	H	Cl	H	H	H	CF3	H	1,99
25	H	Me	Et	H	CF3	H	H	H	CF3	H	2,54
26	H	Me	Et	H	F	H	H	H	CF3	H	1,87
27	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	CF3	H	2,20
28	SH	Me	Et	SH	Me	Me	H	H	tBu	H	4,58
29	H	Me	Et	H	Me	H	H	OMe	OMe	OMe	1,56
30	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	C=NOMe	H	1,94
31	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CMe=NOMe	H	2,02
32	H	Me	Et	H	Me	H	H	Cl	Cl	H	2,21
33	H	Me	Et	H	Me	H	H	Me	F	H	2,04
34	H	Me	Et	H	Me	H	H	F	F	H	1,89
35	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	OPh	H	2,41
36	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	OCH2Ph	H	2,48
37	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CH2OMe	H	1,59
38	H	Me	Et	H	Me	H	H	OMe	OMe	H	1,49
39	H	Me	Et	H	Me	Me	H	OMe	OMe	OMe	1,68
40	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	C=NOMe	H	2,05
41	H	Me	Et	H	Me	Me	H	F	Cl	H	2,32
42	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CMe=NOMe	H	2,24
43	H	Me	Et	H	Me	Me	F	F	F	H	2,32
44	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	Cl	H	2,27
45	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Me	F	H	2,08
46	H	Me	Et	H	Me	Me	H	F	F	H	1,98
47	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OPh	H	2,56
48	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OCH2Ph	H	2,55
49	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CH2OMe	H	1,76
50	H	Me	Et	H	Et	H	H	OMe	OMe	OMe	1,89
51	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	C=NOMe	H	2,09
52	H	Me	Et	H	Et	H	H	F	Cl	H	2,31
53	H	Me	Et	H	Et	H	H	H	CMe=NOMe	H	2,19
54	H	Me	Et	H	Et	H	H	Cl	Cl	H	2,37
55	H	Me	Et	H	Et	H	H	Me	F	H	1,98
56	H	Me	Et	H	Et	H	H	F	F	H	2,00
57	H	Me	Et	H	Et	H	Cl	H	Cl	H	2,26

No.	R1	R2	R3	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
						ortho	meta	para	meta'	
58	H	Me	Et	H	Et	H	H	OMe	H	1.90
59	H	Me	Et	H	Et	H	H	OPh	H	2.32
60	H	Me	Et	H	Et	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.39
61	H	Me	Et	H	Et	H	H	CH ₂ OMe	H	1.67
62	H	Me	Et	H	Et	H	H	OMe	OMe	1.68
63	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OMe	OMe	1.58
64	H	Me	Et	H	Cl	H	H	C=NOMe	H	1.87
65	H	Me	Et	H	Cl	H	H	CMe=NOMe	H	2.00
66	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Cl	H	2.25
67	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Me	F	2.10
68	H	Me	Et	H	Cl	H	H	F	F	1.83
69	H	Me	Et	H	Cl	H	Cl	Cl	H	2.32
70	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OMe	H	1.71
71	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OPh	H	2.45
72	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.48
73	H	Me	Et	H	Cl	H	H	CH ₂ OMe	H	1.65
74	H	Me	Et	H	Cl	H	H	OMe	OMe	1.54
75	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OMe	OMe	1.79
76	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	C=NOMe	H	2.01
77	H	Me	Et	H	F	H	H	C=NOMe	H	1.73
78	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	CMe=NOMe	H	2.24
79	H	Me	Et	H	CF ₃	H	F	F	F	2.29
80	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	Br	H	2.24
81	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	Cl	Cl	2.57
82	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	Me	F	2.20
83	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	F	F	2.09
84	H	Me	Et	H	F	H	H	F	F	1.68
85	H	Me	Et	H	CF ₃	H	Cl	Cl	H	2.39
86	H	Me	Et	H	F	H	Cl	Cl	H	2.05
87	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OMe	H	1.78
88	H	Me	Et	H	F	H	H	OMe	H	1.59
89	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OPh	H	2.65
90	H	Me	Et	H	F	H	H	OPh	H	2.20
91	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.43
92	H	Me	Et	H	F	H	H	OCH ₂ Ph	H	2.27
93	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	CH ₂ OMe	H	1.76
94	H	Me	Et	H	CF ₃	H	H	OMe	OMe	1.71
95	H	Me	Et	H	F	H	H	OMe	OMe	1.41
96	H	Me	Et	H	H	Cl	H	Cl	H	1.92
97	H	Me	Et	H	OMe	OMe	H	Cl	OMe	1.83
98	H	Me	Et	H	OMe	OMe	H	Me	H	1.89
99	H	Me	Et	H	Me	F	H	Cl	H	2.23
100	H	Me	Et	H	H	Cl	H	OCF ₃	H	2.15
101	H	Me	iPr	H	H	Cl	H	Cl	H	2.04
102	H	Me	iPr	H	OMe	OMe	H	Cl	OMe	1.95
103	H	Me	iPr	H	OMe	OMe	H	Me	H	2.01
104	H	Me	iPr	H	Me	F	H	Cl	H	2.22
105	H	Me	iPr	H	H	Cl	H	OCF ₃	H	2.42

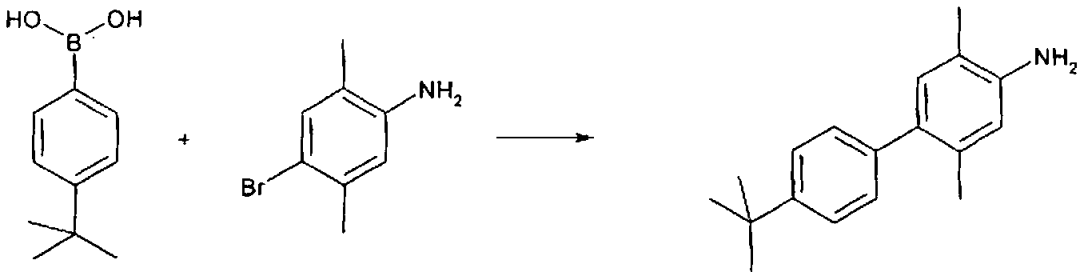
No.	R	R2	R3	R1	R4	R5	R6				log p (HCOOH)
							ortho	meta	para	meta'	
106	H	Me	Et	H	Cl	Me	H	H	tBu	H	2.71
107	H	Me	Et	H	Cl	Me	H	CF3	Cl	H	2.30
108	H	Me	Et	H	Me	H	H	Me	Cl	H	2.14
109	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	2.27
110	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Me	Cl	H	2.13
111	H	Me	Et	H	Me	H	Me	H	Cl	H	2.23
112	H	Me	Et	H	Me	Me	Me	H	Cl	H	2.24
113	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	H	Cl	H	2.03
114	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Me	OMe	H	2.05
115	H	Me	Et	H	Cl	H	H	Me	OMe	H	1.86
116	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	tBu	H	2.69
117	H	CH2CH2CH2CH2CH(CH3)		H	Me	Me	H	H	tBu	H	3.02
118	H	CH2CH2OCH2CH2		H	Me	Me	H	H	tBu	H	2.53
119	H	CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	tBu	H	2.79
120	CH2CH2CH2	H	CH2CH2CH2	Me	Me	H	H	H	tBu	H	2.53
121	CH2CH2CH2CH2	H	CH2CH2CH2CH2	Me	Me	H	H	H	tBu	H	2.60
122	NHCH2CH2CH2	H	NHCH2CH2CH2	Me	Me	H	H	Cl	H	H	2.08
123	NHCH2CH2CH2	H	NHCH2CH2CH2	Me	Me	H	H	F	H	H	1.81
124	NHCH2CH2	H	NHCH2CH2	Me	Me	H	H	F	H	H	1.72
125	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	Cl	H	2.18
126	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	F	H	1.84
127	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CF3	H	2.17
128	H	Me	Et	H	Me	H	H	Cl	H	H	2.01
129	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	tBu	H	2.67
130	H	Me	Et	H	Me	H	H	H	CN	H	1.54
131	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	Me	H	2.01
132	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CF3	H	2.19
133	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	H	H	2.15
134	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	H	H	1.77
135	H	Me	Et	H	Me	Me	-CH=CH-CH=CH-		H	H	2.13
136	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CN	H	1.54
137	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	F	H	2.02
138	CH2CH2CH2CH2	H	CH2CH2CH2CH2	Me	H	H	H	H	tBu	H	2.45
139	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CMc=NOEt	H	2.55
140	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	H	CMc=NOEt	H	2.60
141	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	CMc=NOEt	H	2.22
142	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	CF3	H	2.59
143	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	Cl	CF3	H	2.69
144	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	Cl	CF3	H	2.70
145	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	Cl	CF3	H	2.76
146	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	Me	H	2.37
147	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	Cl	Me	H	2.56
148	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	Cl	Me	H	2.48
149	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	Cl	Me	H	2.53
150	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	Cl	Me	H	2.37
151	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	SiMe3	H	2.98
152	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	H	SiMe3	H	3.10
153	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	H	SiMe3	H	3.08
154	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	SiMe3	H	3.16
155	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	iPr	H	2.34
156	H	Me	Pr	H	Me	Me	H	H	iPr	H	2.70

No.	R1	R2	R3	R1	R4	R5	R6				log P (HCOOH)
							ortho	meta	para	meta	
157	H	Me	Allyl	H	Me	Me	H	H	iPr	H	2.60
158	H	CH2CH2CH2CH2CH2		H	Me	Me	H	H	iPr	H	2.60
159	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	1-Me-1-MeO-Pr	H	2.38
160	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OBu	H	2.28
161	H	Me	iPr	H	Me	Me	H	H	tBu	H	2.77
162	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	iBu	H	2.84
163	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	sBu	H	2.92
164	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Br	tBu	H	3.13
165	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	cyclohexyl	H	3.18
166	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	CH2SiMe3	H	3.18
167	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	cyclopentyl	H	2.94
168	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	tBu	H	2.85
169	H	Me	iPr	H	Me	Me	H	F	tBu	H	2.74
170	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	OPr	H	2.18
171	H	Me	Et	H	Me	Me	H	Cl	OPr	H	2.52
172	H	Me	Et	H	Me	Me	H	F	OPr	H	2.37
173	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	SO2NMe2	H	1.76
174	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	SO2CF3	H	2.21
175	H	Me	Et	H	Me	Me	H	H	Br	H	2.20
176	Me	Me	Et	Me	Me	Me	H	H	tBu	H	2.77
177	H	Me	Et	H	Me	CN	H	H	tBu	H	2.21
178	H	Me	Et	H	Me	Me	H	iPr	H	H	2.42
179	H	Me	Et	H	Me	Me	H	SiMe3	H	H	3.00

Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitativa la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

5

Ejemplo de preparación 1 - Procedimiento (a) - compuesto (IIa) a compuesto (VII): 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina - intermedio (VII-1)

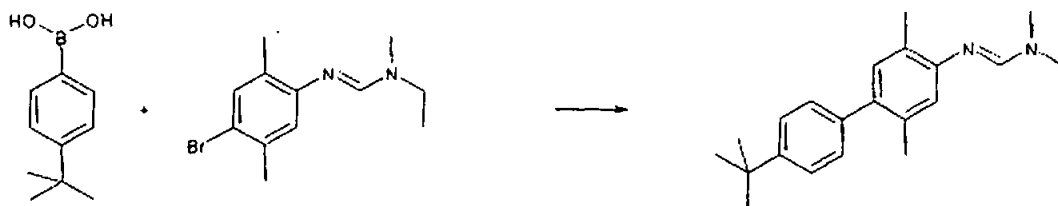


10

La reacción se lleva a cabo usando condiciones inertes (atmósfera de nitrógeno o argón, disolventes secos). Se agitó una suspensión de 6,4 g (36,0 mmol) de ácido (4-terc-butilfenil)bórico, 6,0 g (30,0 mmol) 4-bromo-2,5-dimetilanilina, 29,3 g (90 mmol) carbonato de cesio y 0,7 g (0,6 mmol) tetrakis(trifenilfosfin)paladio en 75 ml de 1,2-dimetoxietano durante 16 horas a 80°C. A temperatura ambiente, se añadieron 25 ml de agua y 75 ml de tolueno. La capa orgánica se separó, la capa acuosa se extrajo nuevamente usando 75 ml de tolueno. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron *in vacuo*. La cromatografía en columna (ciclohexano / acetato de etilo: 2/1) produjo 5,5 g (21,7 mmol) 72% de 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina (log P (pH 2,3) = 3,65.

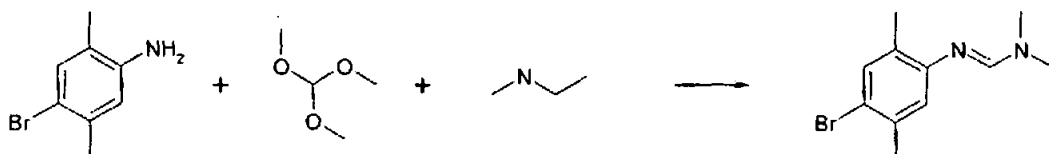
15

Ejemplo de preparación 2 - Procedimiento (a) - compuesto (Va) a compuesto (I): N'-(4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-il)-N-etil-N-metilimidoformamida - compuesto 8



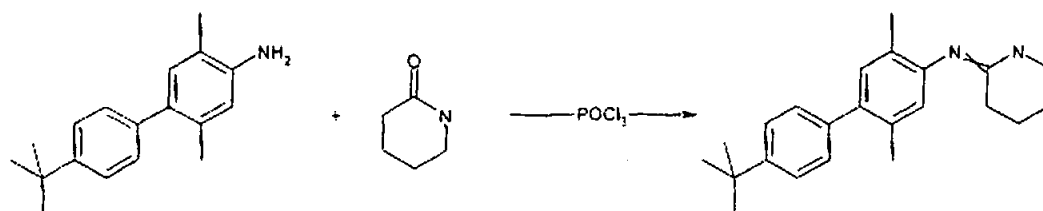
La reacción se lleva a cabo usando condiciones inertes (atmósfera de nitrógeno o argón, disolventes secos). Se agitó una suspensión de 0,3 g (1,8 mmol) de ácido (4-terc-butilfenil)bórico, 0,4 g (1,5 mmol) de N'-(4-bromo-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, 1,5 g (4,5 mmol) carbonato de cesio y 0,03 g (0,03 mmol) tetrakis(trifenilfosfin)paladio en 3,5 ml de 1,2-dimetoxietano durante 16 horas a 80°C. A temperatura ambiente, se añadieron 5 ml de agua y 15 ml de tolueno. La capa orgánica se separó, la capa acuosa se extrajo nuevamente usando 15 ml de tolueno. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron *in vacuo*. La cromatografía en columna (ciclohexano / acetona: 4/1) produjo 0,23 g (0,7 mmol) 47% de N'-(4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-il)-N-etil-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 2,67.

Ejemplo de preparación 3 - Procedimiento (d3) - compuesto (IIa) a compuesto (Va): N'-(4-bromo-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida - intermedio (Va-1)



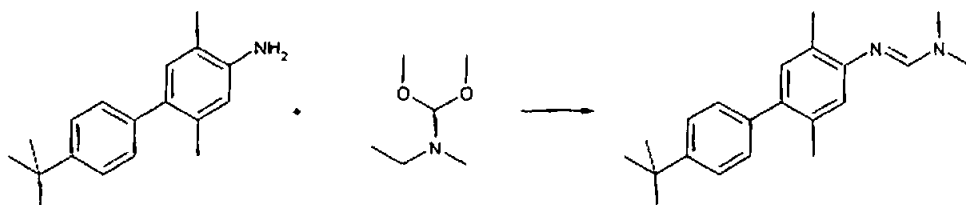
A una mezcla de 10,0 g (50 mmol) de 4-bromo-2,5-dimetilanilina y 126 ml (1,15 mol) de trimetoximetano se le añadieron 0,86 g (5 mmol) de ácido p-tolueno sulfónico. La mezcla de reacción se sometió a reflujo durante 16 horas y se concentró *in vacuo*. El producto bruto se disolvió en 50 ml de diclorometano y se añadieron 5,9 g (100 mmol) de N-metiletanamina. La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró *in vacuo*. La cromatografía en columna (gradiente: éter de petróleo -> éter metil-terc butílico) produjo 5,2 g (19,5 mmol) 39% de N'-(4-bromo-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 1,36.

Ejemplo de preparación 4 - Procedimiento (d1) - compuesto (VII) a compuesto (I): 4'-terc-butil-2,5-dimetil-N-[piperidin-2-iliden]bifenil-4-amina - compuesto 121



Se añadió una disolución de 0,2 g (1,5 mmol) de tricloruro fosfórico en 5 ml de tolueno a una mezcla de 0,3 g (3,0 mmol) de piperidin-2-ona, la reacción exotérmica se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Luego se añadió una disolución de 0,38 g (1,5 mmol) de 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina en 5 ml de tolueno y la mezcla de reacción se sometió a reflujo durante 5 horas. A temperatura ambiente, se añadieron 5 ml de una disolución acuosa al 10% de hidróxido de sodio. La separación de las capas, la extracción de la capa acuosa con 10 ml de tolueno, el secado sobre sulfato de magnesio, la concentración *in vacuo* y la cromatografía en columna (gradiente: ciclohexano -> acetato de etilo) produjeron 0,3 g (1,0 mmol) 63% de 4'-terc-butil-2,5-dimetil-N-[piperidin-2-ilideno]bifenil-4-amina; log P (pH 2,3) = 2,6.

Ejemplo de preparación 5 - Procedimiento (d2) - compuesto (VII) a compuesto (I): N'-(4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-il)-N-etil-N-metilimidoformamida - compuesto 8



A una mezcla de 2,1 g (6,3 mmol) de 4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-amina en 2,5 ml metanol se le añadió una disolución de 8,8 mmol de N-(dimetoximetil)-N-metiletanamina (60% en metanol). La mezcla de reacción se agitó durante 24 horas a 45 °C. La mezcla de reacción se concentró *in vacuo*. La cromatografía en columna (gradiente: ciclohexano -> acetato de etilo) proporcionó 0,96 g (3,0 mmol) 47% de N'-(4'-terc-butil-2,5-dimetilbifenil-4-il)-N-etil-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 2,67.

Ejemplo de eficacia A : Ensayo preventivo *in vivo* en *Puccinia recondita* f. *Sp. tritici* (roya del trigo).

Disolvente: 50 partes en peso de N,N-dimetilacetamida
Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

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

Para probar la actividad preventiva, se inoculan plantas jóvenes con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* en una disolución de agar acuosa al 0,1%. Después de que el recubrimiento por pulverización se ha secado, las plantas se pulverizan con la preparación de compuesto activo en la dosis de aplicación indicada. Las plantas permanecen durante 24 horas en una cabina de incubación a 20°C y una humedad atmosférica relativa del 100%.

Las plantas se colocan en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80% para promover el desarrollo de las pústulas de roya.

10

El ensayo se evalúa 10 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia del 70% o o incluso mayor a una concentración de 1000 ppm de ingrediente activo: 1, 2, 3, 7, 8, 10, 16, 17, 21, 28, 31, 33, 34, 35, 39, 4, 47, 64, 73, 96, 97, 98, 106, 107, 108, 109, 110, 112, 114, 115, 116, 122, 123, 125, 127, 129, 131, 132, 133, 136, 145, 146, 149, 151, 155, 156, 160, 162, 163, 164, 165, 167, 169.

20 Ejemplo de eficacia B: Ensayo preventivo in vivo en *Erysiphe graminis* (oidio en cebada)

Disolvente: 50 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo o combinación de compuestos activos se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsificante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo o la combinación de compuesto activo en la dosis de aplicación indicada.

30

Después de que se ha secado el recubrimiento de pulverización, las plantas se espolvorearon con esporas de *Erysiphe graminis f.sp. hordei*.

Las plantas se colocan en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80% para promover el desarrollo de las pústulas de mildiú.

35

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

En este ensayo, los siguientes compuestos según la invención demostraron una eficacia del 70% o o incluso mayor a una concentración de 1000 ppm de ingrediente activo: 1, 2, 7, 8, 10, 17, 18, 21, 28, 31, 33, 34, 35, 40, 47, 73, 96, 97, 100, 106, 107, 108, 109, 112, 114, 115, 116, 123, 127, 129, 132, 133, 138.

10 Ejemplo de eficacia C: Ensayo protector *in vivo* en *Alternaria solani* (Manchas foliares de tomate)

Disolvente: 49 partes en peso de N, N - dimetilformamida
Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaryl poliglicoléter

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

20 Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo a la dosis de aplicación indicada. Después de que se ha secado el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani*. Las plantas permanecen durante un día en una cabina de incubación a 20°C y una humedad atmosférica relativa del 100%. Luego las plantas se colocan en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa del 96%.

25 El ensayo se evalúa 7 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo, los compuestos según la invención de la siguiente fórmula revelaron una eficacia del 70% o mayor a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: 8, 31, 35, 36, 39, 40, 41, 43, 47, 76, 77, 78, 106, 119, 123, 129, 132, 133.

35 Ejemplo de eficacia D : ensayo protector *in vivo* en *Podosphaera leucotricha* (manzanas).

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
24,5 partes en peso de dimetilacetamida
Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaryl poliglicol éter

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

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo a la dosis de aplicación indicada. Después de que se seca el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causal de moho en la manzana (*Podosphaera leucotricha*). Luego las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 23°C y una humedad atmosférica relativa del 70%.

El ensayo se evalúa 10 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo, los compuestos según la invención de las siguientes estructuras demostraron una eficacia del 70% o incluso mayor a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: 1, 8, 27, 28, 40, 106, 112, 129, 132, 133, 155, 160.

15 Ejemplo de eficacia E: Ensayo protector *in vivo* en *Sphaerotheca fuliginea* (pepinos)

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
24,5 partes en peso de dimetilacetamida
Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

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

25 Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo en la dosis de aplicación indicada. Después de que se ha secado el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea*. Luego las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 23°C y una humedad atmosférica relativa del 70%.

30 El ensayo se evalúa 7 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo, los compuestos según la invención de las siguientes estructuras demostraron una eficacia del 70% o incluso mayor a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: 1, 8, 17, 27, 28, 40, 106, 112, 114, 122, 123, 124, 129, 132, 133, 145, 155.

Ejemplo de eficacia F: Ensayo protector *in vivo* en *Botrytis cinerea* (judías)

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
24,5 partes en peso de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

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

Para probar la actividad protectora, se pulverizan plantas jóvenes con la preparación de compuesto activo. Después de que el recubrimiento por pulverización se seca, se disponen en cada hoja 2 piezas pequeñas de agar cubiertas con *Botrytis cinerea*. Las plantas inoculadas se disponen en una cámara oscura a 20° C y una humedad atmosférica relativa del 100%.

2 días después de la inoculación, se evalúa el tamaño de las lesiones en las hojas. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo los compuestos según la invención de las siguientes estructuras mostraban eficacia de 70% o incluso mayor a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: 8, 40, 47, 106, 129, 132, 133.

Ejemplo de eficacia G: Ensayo protector *in vivo* en *Uromyces appendiculatus* (judías)

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
24,5 partes en peso de dimetilacetamida
Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

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

Para ensayar la actividad protectora, los brotes se pulverizan con la preparación del compuesto activo a la dosis de aplicación indicada. Después de que se seca el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causal de roya de judías (*Uromyces appendiculatus*) y luego se dejan durante 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa del 100%.

Luego las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 21°C y una humedad atmosférica relativa del 90%.

El ensayo se evalúa 10 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En este ensayo, los compuestos según la invención de las siguientes estructuras demostraron una eficacia del 70% o incluso mayor a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: 129, 132, 133, 155, 160.

5

Ejemplo de eficacia H: Ensayo protector *in vivo* en *Aedes Aegypti* (AEDSAE U)

Disolvente: 1 % N-metilpirrolidona (NMP)
1% alcohol de diacetona

Tinte: sulfotlavin brillante para agua colorante

- 10 Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, éste se mezcla con cantidades indicadas de disolvente, y el concentrado se diluye con agua colorante en la concentración deseada.

Se introducen con pipeta larvas *Aedes aegypti* a una preparación de ingrediente activo a la concentración deseada.

- 15 Después del período de tiempo especificado, se determina la mortalidad en %. 100% significa que todas las larvas han sido exterminadas, 0% significa que no se ha exterminado ninguna larva.

En este ensayo, los siguientes compuestos del ejemplo de preparación exhiben buena actividad: 9, 18, 19, 26, 47, 54, 77, 99, 100, 104, 105, 127, 128, 129.

20

Ejemplo de eficacia I: *Heliotis virescens* – Ensayo en *Heliotis virescens* (HELIVI aplicación por pulverización):

Disolvente: 78 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida

- 25 Agente humectante 0,5 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

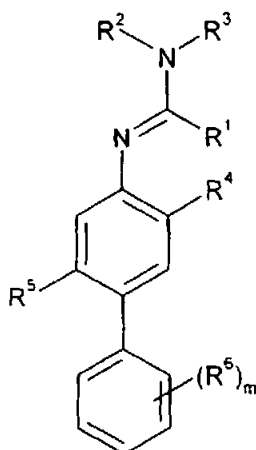
Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsificante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsificante a la concentración deseada.

Se rocían cortes de hoja de soja (*Glycine max.*) con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secos, los cortes de hoja se infestan con huevos de gusano del algodón (*Heliothis virescens*).

- Después del período de tiempo especificado, se determina la mortalidad en %. 100% significa que todos los huevos han sido destruidos, 0% significa que no se ha destruido ningún huevo.
- 5 En este ensayo, por ejemplo, el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación demostró buena actividad: 26.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de fenilamidina de fórmula (I):



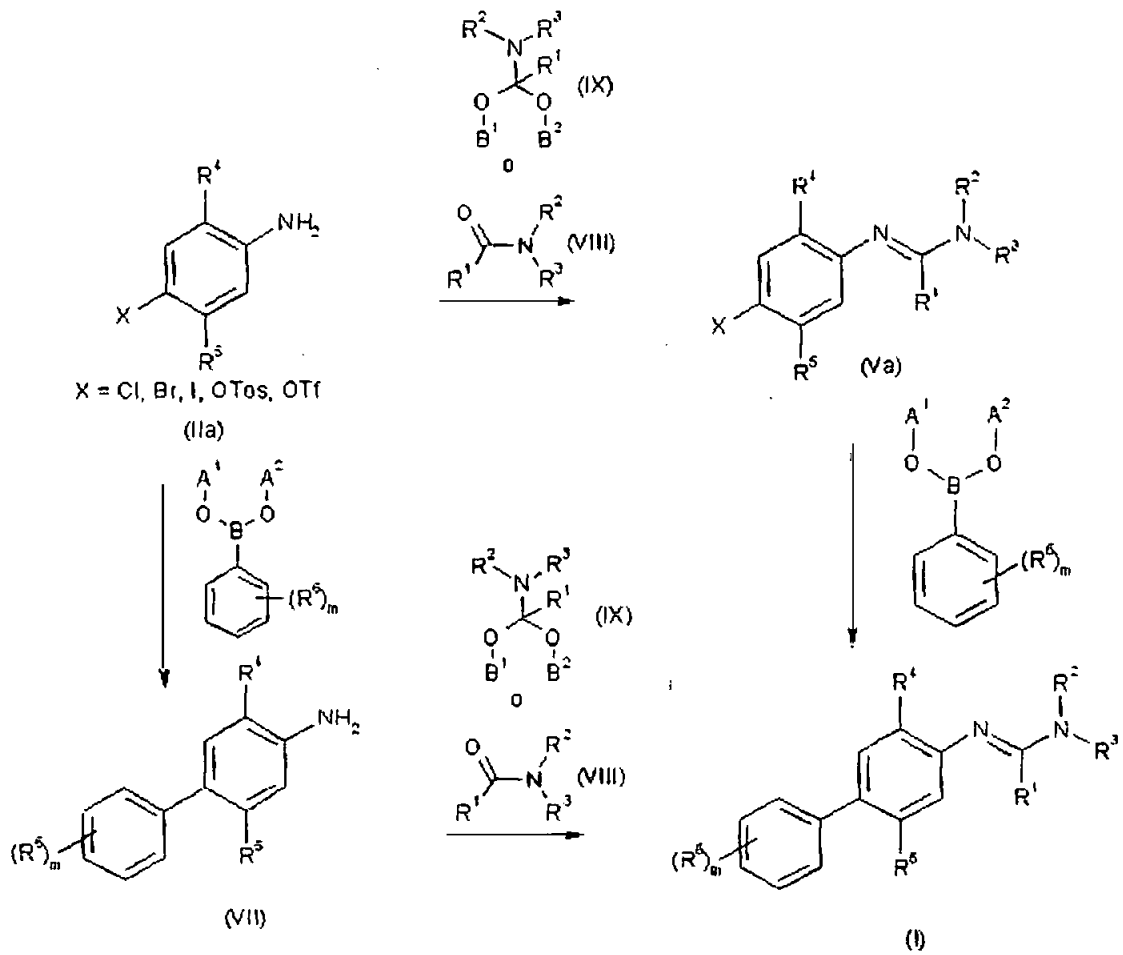
(I)

en la que

- R^1 representa H, un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un alquenilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un alquinilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, SH o un S-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido;
- R^2 representa un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido;
- R^3 representa un alquilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C_3-C_6 sustituido o no sustituido, un alquenilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un alquinilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, halógeno-alquilo C_1-C_{12} ;
- R^1 y R^2 , R^1 y R^3 o R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo de 5 a 7 miembros sustituido o no sustituido;
- R^4 representa un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un átomo de halógeno, halógeno-alquilo C_1-C_{12} , O-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido o ciano;
- R^5 representa un H, un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un átomo de halógeno, halógeno-alquilo C_1-C_{12} , O-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido o ciano;
- R^6 representa H, un átomo de halógeno, nitro, ciano, trialquilsililo, alquilo C_1-C_8 , alquilo C_1-C_4 sustituido o no sustituido-fenilo, fenilo sustituido o no sustituido, alcoxi C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_8 , halógeno-alquilo C_1-C_6 , halógeno-alcoxi C_1-C_6 , halógeno-alquiltio C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 sustituido o no sustituido-fenilo como benciloxi, fenoxi sustituido o no sustituido, alquilamino C_1-C_8 - NR^7R^8 sustituido o no sustituido-, NR^7R^8 sustituido o no sustituido, alquil C_1-C_8 - $S(O)_nR^9$, $-S(O)_nR^9$, alquil C_1-C_8 - $SO_2NR^7R^8$, $-SO_2NR^7R^8$, alquil C_1-C_8 - $C(O)R^{10}$, $-CR^9=N-O-R^{11}$; o
- dos sustituyentes R^6 pueden formar un anillo carbocíclico o heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista de O, N, S;

- n representa 0, 1 ó 2;
 - R^7 y R^8 , que pueden ser iguales o diferentes, representan H, alquilo C_1-C_6 sustituido o no sustituido;
 - R^7 y R^8 pueden formar un anillo heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S;
 - 5 • R^9 representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado sustituido o no sustituido, alquenilo C_1-C_8 , alquinilo C_1-C_8 ;
 - R^{10} representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado sustituido o no sustituido, alcoxi C_1-C_8 , NR^7R^8 ;
 - 10 • R^{11} representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado sustituido o no sustituido, alquil C_1-C_4 -fenilo, alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alquilo C_1-C_4 sustituido o no sustituido-fenilo, fenilo sustituido o no sustituido;
 - R^9 y R^{11} pueden formar un anillo heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S;
 - 15 • m representa 1, 2, 3, 4, 5.
2. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en el que
- R^1 representa H, alquilo C_1-C_{12} o SH; o
 - R^2 representa metilo; o
 - 20 • R^3 representa alquilo C_2-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_6 ; o
 - R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo de 5 a 7 miembros sustituido o no sustituido; o
 - R^4 representa alquilo C_1-C_{12} , un átomo de halógeno o trifluorometilo; o
 - R^5 representa H, alquilo C_1-C_{12} , un átomo de halógeno o trifluorometilo; o
 - 25 • R^6 , que puede ser igual o diferente, representa H; F, Cl, Br, I; nitro; ciano; alquilo C_1-C_6 ; alquil C_1-C_4 -fenilo que puede no estar sustituido o estar sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógeno-alquilo C_1-C_4 ; fenilo que puede no estar sustituido o estar sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógeno-alquilo C_1-C_4 ; alcoxi C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ; alquiltio C_1-C_6 ; halógeno-alquilo C_1-C_6 ; halógeno-alquilo C_1-C_6 ; halógeno-alquiltio C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ; alquiltio C_1-C_6 ; benciloxi que puede no estar sustituido o estar sustituido con halógeno; fenoxi que puede no estar sustituido o estar sustituido con un átomo de halógeno o CF_3 ; NR^7R^8 ; alquilo C_1-C_4 - NR^7R^8 ; $S(O)_nR^9$; alquilo C_1-C_4 - $S(O)_nR^9$; OR^{10} ; alquilo C_1-C_4 - COR^{10} ; $-CR^9=N-O-R^{11}$; o
 - 30 • dos sustituyentes R^6 pueden formar un anillo carbocíclico o heterocíclico, que puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista de O, N, S; o
 - 35 • R^7 y R^8 , que pueden ser iguales o diferentes, representan H, alquilo C_1-C_6 que puede ser igual o diferente; o

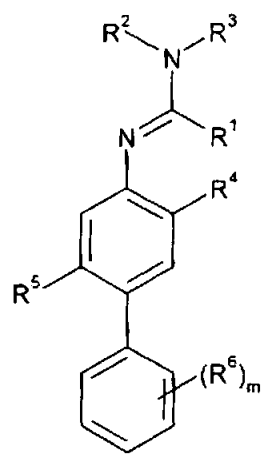
- R^7 y R^8 pueden formar un anillo heterocíclico que comprende otros heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S; o
 - R^9 representa H, metilo o etilo; o
 - R^{10} representa H, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o NR^7R^8 ; o
 - 5 • R^{11} representa H; alquilo C_1-C_4 ; halógeno-alquilo C_1-C_4 ; alquil C_1-C_4 -fenilo en el que el fenilo puede estar sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ; fenoxi; benciloxi; o
 - R^9 y R^{11} pueden formar un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que comprende otros heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, S, N; o
 - 10 • m representa 1, 2, 3 ó 4.
3. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2, en el que
- R^1 representa alquilo C_1-C_{12} ; o
 - R^3 representa un alquilo C_2-C_4 no sustituido, alqueno C_3-C_4 o ciclopropilo; o
 - 15 • R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo de 6 miembros; o
 - R^4 representa un alquilo C_1-C_{12} no sustituido, un átomo de cloro o flúor; o
 - R_5 representa un alquilo C_1-C_{12} no sustituido, un átomo de cloro o flúor; o
 - m representa 1, 2 ó 3.
- 20 4. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, en el que
- R^1 representa metilo; o
 - R^3 representa etilo, n-propilo, i-propilo, propenilo o alilo; o
 - R^2 y R^3 pueden formar juntos un piridinilo o un pirolidinilo; o
 - R^4 representa metilo o etilo; o
 - 25 • R^5 representa metilo o etilo;
5. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 4, en el que R^2 y R^3 forman juntos un pirolidinilo 2-alquilado.
- 30 6. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 5, en el que R^2 y R^3 forman juntos un 2-metil-pirolidinilo.
7. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, que comprende las siguientes etapas:



8. Un método para controlar los hongos fitopatógenos de los cultivos, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz desde el punto de vista agrícola y prácticamente no fitotóxica de un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6 al suelo en el que crecen o son capaces de crecer las plantas, para las hojas o los frutos de las plantas o las semillas de las plantas.
9. Un método para combatir los insectos dañinos, caracterizado porque se aplica un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6 a la semilla, la planta o el fruto de la planta o el suelo en el que crece la planta o en el que se desea que crezca la planta.

RESUMEN

La presente invención se refiere a derivados de bifenilamidina de fórmula (I) en los que los
5 sustituyentes son tal como en la descripción, a procedimientos para su preparación, su uso
como agentes activos fungicidas o insecticidas, particularmente en la forma de composiciones
fungicidas o insecticidas, y a métodos para el control de hongos fitopatógenos o insectos
dañinos, especialmente de plantas, que usan estos compuestos o composiciones:



102

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066271

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

BALMEFREZOL, Ludovic
Bayer Cropscience SA
Patents & Licensing Department
14-20 Rue Pierre Baizet
F-69009 Lyon
FRANCE

Date of mailing (day/month/year) 31 January 2007 (31.01.2007)	
Applicant's or agent's file reference BCS 05-4026	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2006/066271	International filing date (day/month/year) 12 September 2006 (12.09.2006)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 13 September 2005 (13.09.2005)
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG et al	

1. By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
2. (If applicable) The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
3. (If applicable) An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
13 September 2005 (13.09.2005)	05356153.6	EP	09 January 2007 (09.01.2007)

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Yolaine Cussac

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Facsimile No. +41 22 338 90 84

Telephone No. +41 22 338 90 12

Form PCT/IB/304 (October 2005)

I/C4Y9WPNR0

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2008/066271

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BALMEFREZOL, Ludovic
BAYER CROPSCIENCE SA
Patents & Licensing Department
14-20 Rue Pierre Baizel
F-69009 Lyon
FRANCE

Date of mailing (day/month/year) 07 March 2008 (07.03.2008)	
Applicant's or agent's file reference BCS 05-4026	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2008/066271	International filing date (day/month/year) 12 September 2006 (12.09.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address EBBERT, Ronald Nikolaus-Kopernikus-Strasse 13 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	Teleprinter No.	

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

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

Name and Address EBBERT, Ronald Leskowstrasse 60 90475 Nürnberg Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	Teleprinter No.	

3. Further observations, if necessary:

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

☒ the receiving Office	☒ the designated Offices concerned
☒ the International Searching Authority	☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority	☐ other:

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Blanc Veronique e-mail Veronique.Blanc@wipo.int Telephone No. +41 22 338 96 66
---	--

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Form PCT/IB/306 (October 2005)

1/DKWGE33Q1

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066271

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BALMEFREZOL, Ludovic
BAYER CROPSCIENCE SA
Patents & Licensing Department
14-20 Rue Pierre Baizet
F-69009 Lyon
FRANCEDate of mailing (day/month/year)
07 March 2008 (07.03.2008)Applicant's or agent's file reference
BCS 05-4026International application No.
PCT/EP2006/066271International filing date (day/month/year)
12 September 2006 (12.09.2006)

IMPORTANT NOTIFICATION

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

MORADI, Wahed
Gerstenkamp 12
51061 Köln
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

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

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

Name and Address

MORADI, Wahed
Maria-Merian Strasse 7
40789 Monheim an Rhein
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

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

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

Authorized officer

Blanc Veronique

e-mail Veronique.Blanc@wipo.int
Telephone No. +41 22 338 96 66

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Form PCT/IB/306 (October 2005)

1/DKWF98GT1

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066271

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BALMEFREZOL, Ludovic
BAYER CROPSCIENCE SA
Patents & Licensing Department
14-20 Rue Pierre Baizet
F-69009 Lyon
FRANCEDate of mailing (day/month/year)
07 March 2008 (07.03.2008)Applicant's or agent's file reference
BCS 05-4026

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP2006/066271International filing date (day/month/year)
12 September 2006 (12.09.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

HARTMANN, Benoit
Färberstrasse 1
40764 Langenfeld
Germany

State of Nationality

FR

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

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

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

Name and Address

HARTMANN, Benoit
12 chemin Antoinette
F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon
France

State of Nationality

FR

State of Residence

FR

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

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

☒ the receiving Office ☒ the designated Offices concerned
☒ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other.The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

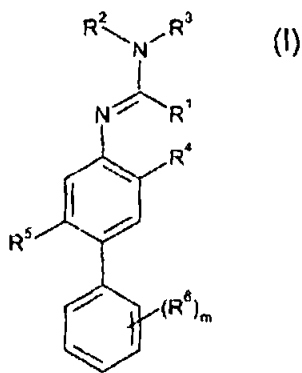
Blanc Veronique

e-mail Veronique.Blanc@wipo.int
Telephone No. +41 22 338 96 66

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT		106
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07C 257/12, A01N 37/52, A01N 43/40, C07D 295/195		
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG		
(30) Prioridad	(31) No. 05356153.6	32) Fecha 13/09/05	(33) Pais US	(72) Inventor(es) KUNZ, KLAUS GREUL, JÖRG y otros
				(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ
(85)	Fecha límite inicio fase nacional: 13/04/08		(87) Publicación internacional	
(86)	Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 22/03/07	
	Fecha de presentación de la solicitud: 12/09/06		N° publicación: WO/2007/031512	
	No. de solicitud PCT/EP2006/066271			
(54) Título: DERIVADOS PLAGUICIDAS DE BIFENILAMIDA				

La presente invención se refiere a derivados de bifenilamida de fórmula (I), en los que los susituyentes son tal como se definen en la descripción, a procedimientos para su preparación, su uso como agentes activos fungicidas o insecticidas, particularmente en la forma de composiciones fungicidas o insecticidas, y a métodos para el control de hongos fitopatógenos o insectos dañinos, especialmente en plantas, que usan estos compuestos o composiciones:





No. 08-034060- -00000-0000

Fecha: 2008-04-04 16:27:57 Dep. 2020 NUECREACION
 Tra. 11 PATENTE/II Eje: 378 FASENACIONAL
 Act. 411 PRESENTACION Folios: 108



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Délegatura de Propiedad Industrial
 División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

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

Firma Responsable:

Fecha:

Abril, 2008

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CORREA ORDOÑEZ ALVARO

REFERENCIA	Radicación No.	8 34060
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/066271
	Fecha inicio fase nacional	13/04/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	5959

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

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

2. La solicitud no contiene el poder debidamente otorgado, con el lleno de los requisitos exigidos por los artículos 63 y subsiguientes del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el documento que acredita la existencia y representación legal de la sociedad solicitante, cuando ésta fuere persona jurídica.

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

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

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 09 MAYO 2008
jfernand