

Doctor

José Luis Salazar

Director de Nuevas Creaciones (C)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y

E. S.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-034065- -00008-0000

Fecha: 2012-07-10 16:37:02 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 73

Referencia: Expediente No. 08.034.065

Solicitud de Patente de Invención titulada: "Derivados plaguicidas de fenilamina sustituida con tiazoliloxi".

Solicitante: Bayer CropScience AG

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA NO. 170
DEL 11 DE ABRIL DE 2012, OFICIO NO. 05594 (EXAMEN DE FONDO)

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término legal:

1. Objeciones del Examinador

1.1 Reivindicaciones de uso

Con relación a las reivindicaciones 9 y 10, el examinador menciona que un método cuya

única etapa es una aplicación corresponde tan solo a una aplicación, y una aplicación es un uso. Por lo tanto su Despacho sugiere que se elimine dichas reivindicaciones.

1.2 Claridad de las reivindicaciones:

Su Despacho establece que el capítulo reivindicatorio no es conciso ya que incluye generalizaciones estructurales demasiado amplias respecto a lo soportado en la descripción y las reivindicaciones de procedimiento no definen apropiadamente el objeto de protección.

Se menciona además que las reivindicaciones 1 y 2 no son claras pues emplean las expresiones “uno o más” o “como”. Adicionalmente, se establece que las definiciones R1, R2, R3...R10 son demasiado amplias en comparación con lo mostrado en los ejemplos.

El examinador afirma que no se definen los posibles sustituyentes que pueden tener cada grupo y que cuando se menciona el término “heterociclo de 5 a 7 miembros” no se definen los heteroátomos que los conforman.

Su Despacho sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que se encuentran descritos en las tablas 1, 2 y 3 y los ejemplos.

Se menciona que los términos “pipiridinilo”, “pirolidinilo” no son aceptados y que se deben corregir los nombres.

Por último, se cita que las reivindicaciones 7-8 no establecen de manera completa las características técnicas esenciales del procedimiento que se desea proteger en cada una de las reivindicaciones y que en ellas se incluye una etapa de reacción con alcoxiamina que no es necesaria para obtener el núcleo general de los compuestos de formula I. El examinador sugiere escribir esta etapa opcional en una reivindicación dependiente y evitar usar el mismo símbolo “=” para referirse a “igual” y a “doble enlace” para facilitar comprensión.

1.3 Descripción:

Con relación a la descripción se menciona que no es clara porque emplea símbolos de doble

enlace CN en las estructuras de los ejemplos que no son aceptados en el campo técnico de química y que el término “ligante” empleado en el folio 66 no se encuentra previamente referido en el documento.

El examinador también menciona que la descripción no divulga la invención de manera suficientemente completa para dar soporte a las generalizaciones divulgadas en las reivindicaciones. Además, no se muestran pruebas del efecto técnico de mejora en la actividad fungicida respecto a las estructuras conocidas.

1.4 Novedad

El Examinador establece que el documento **D1** WO 0046184 afecta la novedad de las reivindicaciones 1 a 3 debido principalmente a lo siguiente:

“las características esenciales de la familia de compuestos de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer una gran variedad de derivados de N-fenilamidina (pág 34-47, Tabla 1) entre los cuales se encuentran varios compuestos No. 48, 66, 68, 72, 81-83, 85-86, 112-113, 116-117, 120, 123, 126.....(D1, tabla 1) que afectan la novedad de la presente invención”.

1.5 Nivel Inventivo

Sobre el requisito del nivel inventivo, el Examinador establece que para la persona del oficio medianamente versada en la materia, sería obvio modificar la naturaleza de los radicales R1, R2 en conjunto con R3 y el radical R6 sobre el compuesto 246 divulgado en **D1**, de acuerdo a sus mismas enseñanzas, con el fin de obtener más compuestos con la misma actividad. Por lo cual la reivindicación 4 y sus dependientes 5-6 se consideran obvias.

Con relación a la reivindicación 7 se menciona que la diferencia entre dicha reivindicación y el procedimiento de **D1** es que la presente invención además del método mostrado en **D1**, incluye otros métodos de formación de amidinas a partir de anilinas como son: la obtención por reacción con carboxamidas (etapa b1). Sin embargo, el método de formación de fenilamidinas de la Etapa b1 presentado en la invención ya había sido divulgado previamente en el documento **D2** (US4072675) (Columna 10, líneas 8-14) el cual enseña un procedimiento general y común para obtener fenilamidinas a partir de la anilina

correspondiente y la carboxamida apropiada.

Concluye su Despacho que para la persona del oficio medianamente versada en la materia, sería obvio emplear los métodos de formación de amidinas divulgadas en **D1** e incluir el método alternativo divulgado en **D2** con el fin de obtener los derivados de fenilamidinas reclamados en la presente solicitud, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

Por último, con relación a la reivindicación 8 se menciona que la diferencia entre la reivindicación 8, y el procedimiento de **D1** es que la presente invención además del método mostrado en **D1**, incluye otro método de formación de amidinas a partir de anilinas por reacción con ortoésteres (Etapa b3). Sin embargo, el método de formación de fenilamidinas de la llamada etapa b3 presentado en la invención ya había sido divulgado previamente en el documento **D3** (todo el documento) el cual enseña un procedimiento para sintetizar amidinas, por medio de la reacción entre una amina y un ortoéster.

Por lo tanto, para una persona del oficio medianamente versada en la materia, sería obvio emplear los métodos de formación de amidinas divulgados en **D1** e incluir el método alternativo divulgado en **D3** con el fin de obtener los derivados de fenilamidinas reclamados en la presente solicitud, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

2. Argumentos a favor de la patentabilidad de la solicitud

2.1 Modificación a una solicitud en trámite

De conformidad con el artículo 34 de la Decisión 486, y con el propósito de atender a las observaciones del examinador con relación a la falta de claridad de las reivindicaciones, y en la descripción y falta de novedad y nivel inventivo me permito presentar un nuevo pliego reivindicatorio como sustituto del anteriormente presentado conformado por 4 reivindicaciones.

En particular se efectuaron los siguientes cambios:

2.1.1 Reivindicaciones:

Las reivindicaciones 9 y 10 se cancelaron del nuevo pliego reivindicatorio. Así mismo, se

cancelaron los términos “uno o más” o “como” del capítulo reivindicatorio.

Los términos: “sustituido o no sustituido”, “heterociclo de 5 a 7 miembros”, “pipiridinilo” “pirolidinilo” ya no aparecen en el pliego reivindicatorio.

De conformidad con las observaciones del examinador, informamos a su Despacho que el alcance de la invención se ha limitado a las definiciones de los ejemplos de la solicitud en estudio. La nueva reivindicación 1 se encuentra totalmente sustentada en las tablas 1,2 y 3 de la memoria descriptiva.

Por otro lado, informamos a su Despacho que las reivindicaciones de procedimiento se han limitado de tal forma que incluyen los diluyentes, ácidos, bases, agentes de condensación y los rangos de temperatura que aparecen en la descripción de la solicitud.

El símbolo “=” se canceló de las reivindicaciones.

Así mismo, de conformidad con la sugerencia del examinador la etapa de reacción con alcoxiamina se redactó en una reivindicación dependiente.

2.1.2 Descripción:

Con relación al término “ligantes” del folio 66, informamos a su Despacho que se cambió dicho término por “bases adecuadas”. Presentamos nuevamente página 14 de la descripción.

Por otro lado, con relación a que no se acepta el símbolo de doble enlace CN en las estructuras de los ejemplos, presentamos nuevas páginas 10, 13, 32, 33 y 34.

De lo anterior es claro, que con las modificaciones efectuadas al pliego reivindicatorio así como a la descripción se supera las observaciones de claridad.

Por último, se informa a su Despacho que se presenta adjunto a este memorial ejemplos que demuestran la mejora en la actividad fungicida con respecto al arte previo más cercano a la presente invención.

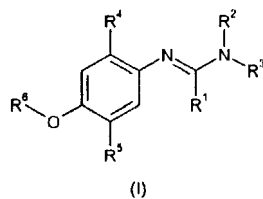
2.2 Novedad

La novedad de una solicitud está legalmente definida en el Artículo 16 de la Decisión 486 así: *“una invención se considerará nueva, cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso de la prioridad reconocida...”*

En virtud de la anterior definición, consideramos que el documento D1 (WO0046184) no constituye documento del arte previo que afecte la novedad de las reivindicaciones 1 a 3 por lo siguiente:

En primer lugar, debe tenerse en cuenta que mi representada limitó el alcance de la invención específicamente a los compuestos de los ejemplos sustentados en las tablas 1, 2 y 3 de la memoria descriptiva originalmente presentada.

En particular, la presente invención se relaciona con compuestos de conformidad a la fórmula I de la reivindicación 1



donde

R^2 representa un alquilo C_1 - C_{12} sustituido o no sustituido;

R^3 representa un alquilo C_1 - C_{12} sustituido o no sustituido.

Contrario a esto en los compuestos 48, 66, 68, 72, 81-84, 86, 113, 116, 117, 119, 120, 123, 138, 194-197, 206-209, 215-217, 234, 247, 252-254, 259, 298-300, 336-339, 351, 356, 362, 368, 383, 611 citados por el examinador R² y R³ ambos representan residuos de metilo.

La solicitud en estudio también es novedosa con respecto a los compuestos 225, 246 ya que el residuo R⁹ no representa un fenilo no sustituido.

Por consiguiente, en vista de las claras diferencias estructurales existentes, resulta incontrovertible que la presente invención es novedosa frente a las enseñanzas del documento D1.

En conexión con lo anterior, me permito dirigir la atención de su Despacho a las enseñanzas del Manual Andino de Patentes¹, específicamente al acápite 9.4 “Análisis de Novedad” (páginas 65 y 66) en donde se establece: *“Para determinar la novedad de la invención, se debe comprobar si existen anticipaciones del estado de la técnica que contengan **explícitamente todas las características técnicas esenciales de la invención (...)** si **todas las características técnicas de la reivindicación independiente se encuentran descritas en un mismo antecedente** y además se encuentran íntimamente relacionadas, el objeto de dicha reivindicación carece de novedad. Si una característica, aunque sea banal, no se encuentra contenida en el antecedente, la reivindicación es nueva”* (resaltado fuera de texto).

De esta manera, es posible establecer que la novedad de la presente invención solo podrá verse afectada por un documento del arte previo cuando éste provea una **revelación explícita de todas las características técnicas de la presente invención y no haya ninguna diferencia entre la materia reclamada y aquello revelado en un documento del arte previo**, lo cual no ocurre en este caso por lo que debe reconocerse la novedad de la materia reclamada por la presente solicitud.

¹ Manual para el examen de solicitudes de patentes de invención en las Oficinas de Propiedad Industrial de los países de la Comunidad Andina, 2004.

2.3 Nivel inventivo

El nivel inventivo de una solicitud se encuentra definido en el Artículo 18 de la Decisión 486 y se establece cuando *“si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”*.

Contrario a lo que plantea el Examinador, el documento del arte previo citado (D1, D2 y D3) no afecta el nivel inventivo de las reivindicaciones 4-8 de la presente solicitud por cuanto no es posible derivar dichas reivindicaciones a partir de las enseñanzas presentadas en dichos documentos.

Hacemos notar a su Despacho que tanto las reivindicaciones de producto como las de procedimiento fueron modificadas en particular se limitaron a los compuestos de los ejemplos de la descripción. Las reivindicaciones de procedimiento que corresponden a la preparación del compuesto de fórmula (I) de acuerdo a la reivindicación 1 incluyen condiciones como temperatura y los diluyentes, ácidos, bases y agentes de condensación adecuados para llevar a cabo el procedimiento.

Por otro lado, el solicitante llevó a cabo ejemplos comparativos que permiten una comparación elemento por elemento del compuesto No. 2.5 de la presente invención con el arte previo más cercano, compuesto 66 del documento **D1**, compuesto 3.2 de la presente invención con el arte previo más cercano, compuesto 81 de la referencia **D1** y el compuesto 1.75 de la solicitud en estudio con respecto al arte previo más cercano, compuesto 113 del documento **D1**.

Vale la pena citar lo establecido por el Manual Andino para el Examen de solicitudes de patentes de Invención², en cuanto al requisito de nivel inventivo (Por favor, ver página 82):

Información complementaria y ejemplos comparativos

“Ante una objeción por falta de nivel inventivo, el solicitante puede aportar pruebas para apoyar ese nivel en forma de argumentos o documentos, por ejemplo, para

² Manual para el examen de solicitudes de patentes de invención en las Oficinas de Propiedad Industrial de los países de la Comunidad Andina, OMPI, 2004.

demostrar que había un prejuicio técnico que llevaba a la persona versada en la materia en sentido contrario a la invención, o bien, mediante ensayos especialmente comparativos para demostrar la presencia de un efecto técnico o ventaja de la invención, respecto del estado de la técnica más cercano". La negrilla es mía.

Por favor, nótese que los ejemplos comparativos adjuntos claramente demuestran una actividad fungicida mejorada de los compuestos de la presente invención en comparación con los compuestos del arte previo más cercano del documento D1.

Este incremento en la actividad habría sido sorprendente para una persona medianamente experta en la técnica y no hubiera sido previsible del estado de la técnica. Por lo tanto, la materia objeto reclamada no solamente es nueva sino que también cumple con el requisito de nivel inventivo.

En este orden de ideas, tenemos que la invención propuesta por el solicitante si cumple con los requisitos de patentabilidad y de esta manera es susceptible de ostentar el título de patente de invención.

3. Solicitudes concedidas en otros países para esta misma invención.

A manera informativa, pongo en conocimiento del Examinador que la solicitud de patente Chilena No. 2385-2006 equivalente a la presente solicitud ha sido aceptada para otorgamiento, la solicitud europea aún está en trámite. Aún cuando entiendo que estas decisiones de ninguna manera obligan al Despacho para decidir de igual forma, considero que por tratarse de una pregunta fáctica la determinación de la existencia de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial, las decisiones de otras oficinas de patentes constituyen un antecedente persuasivo en la materia.

En virtud de lo anterior, solicito que se acepten las razones expuestas en el presente documento y en consecuencia, se otorgue el privilegio de patente de invención para el invento que se tramita en este expediente.

Atentamente,


ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281

Anexos: Datos comparativos
 Nueva memoria descriptiva
 Capítulo reivindicatorio modificado
 Copia de la notificación de otorgamiento de la patente Chilena.

BM_ALMGT/BOGDMS-#1134597-V1-P2008_000010-0720.DOC

Encl.: Comparative Examples Colombian Patent Appl. No.: 08.034.065

Leptosphaeria test (wheat) / preventive

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

Emulsifier: 1 part by weight of Alkylarylpolyglycoether

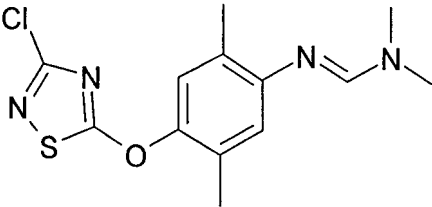
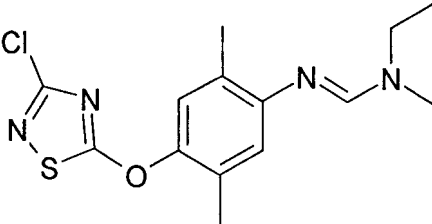
To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for preventive activity, young plants are sprayed with a preparation of active compound at the stated rate of application. One day after this treatment, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Leptosphaeria nodorum*. The plants remain for 48 hours in an incubation cabinet at 22°C and a relative atmospheric humidity of 100%. Then the plants are placed in a greenhouse at a temperature of approximately 22°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90%.

The test is evaluated 7-9 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

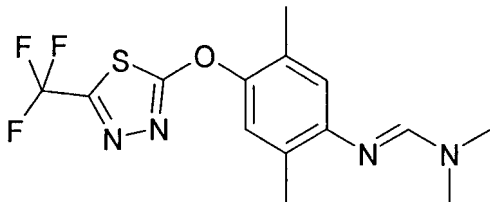
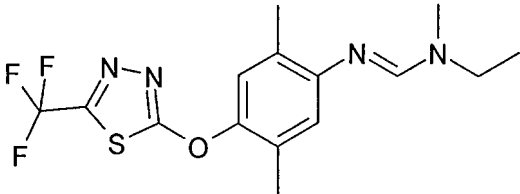
Table

Leptosphaeria test (wheat) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 66		500	10
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 2.5		500	95

Table

Leptosphaeria test (wheat) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 81		500	30
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 3.2		500	90

Example**Podosphaera test (apples) / preventive**

Solvent: 24,5 parts by weight of acetone

24,5 parts by weight of dimethylacetamide

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

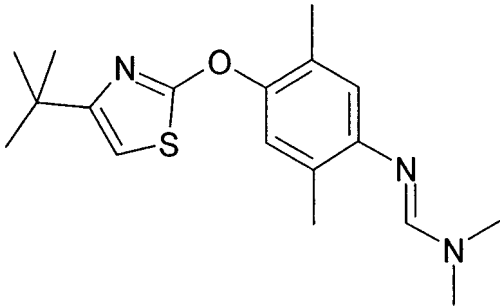
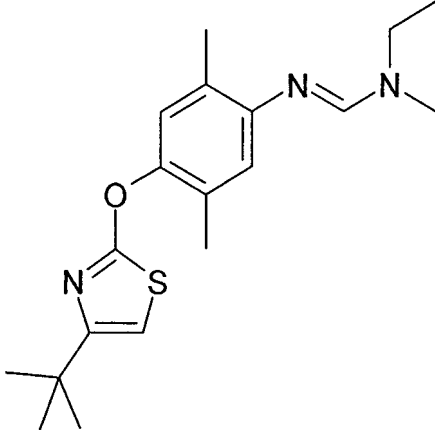
To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

To test for preventive activity, young plants are 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 apple mildew (*Podosphaera leucotricha*). 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 untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

Table

Podosphaera test (apples) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 113		100	5
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 1.75		100	100

Example**Blumeria test (barley) / preventive**

Solvent: 49 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.

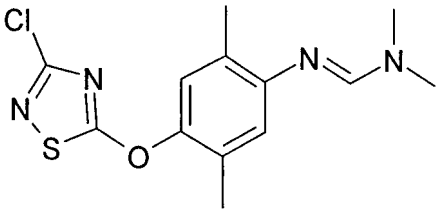
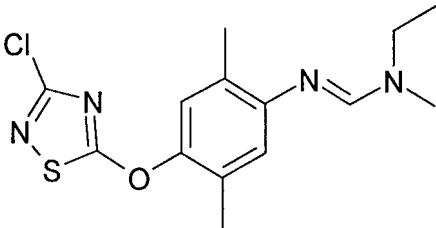
After the spray coating has been dried, the plants are dusted with spores of *Blumeria graminis f.sp. hordei*.

The plants are placed in the greenhouse at a temperature of approximately 18°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 untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

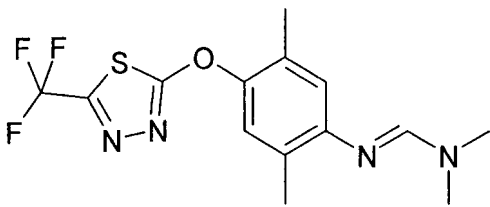
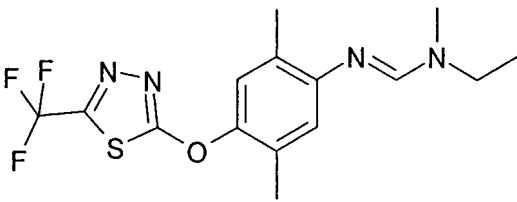
Table

Blumeria test (barley) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 66.		1000	11
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 2.5		1000	100

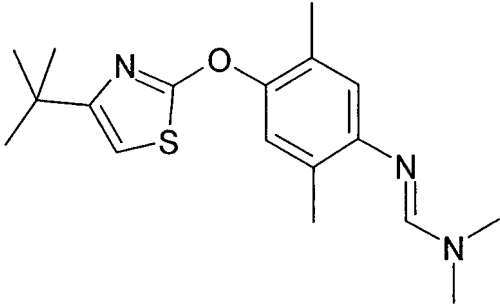
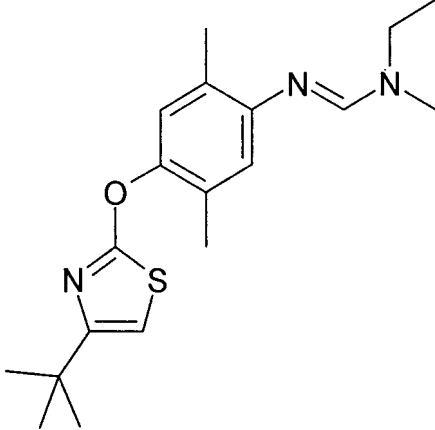
Table

Blumeria test (barley) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 81		1000	78
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 3.2		1000	100

Table

Blumeria test (barley) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 113		1000	78
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 1.75		1000	94

Example**Pyrenophora teres-test (barley) / preventive**

Solvent: 49 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.

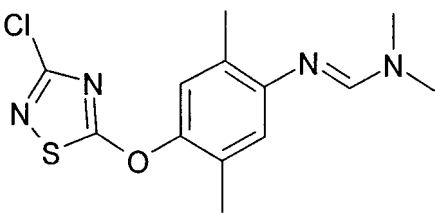
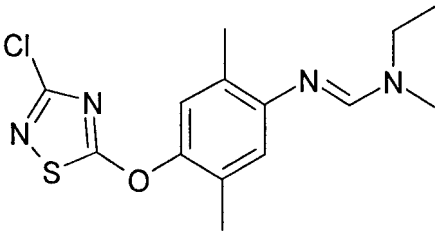
After the spray coating has been dried, the plants are sprayed with a spore suspension of *Pyrenophora teres*. The plants remain for 48 hours in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100%.

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

The test is evaluated 8 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

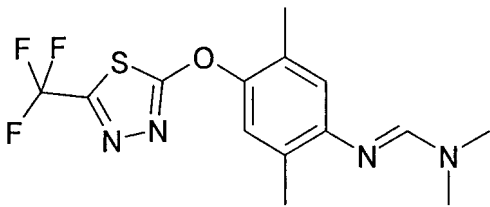
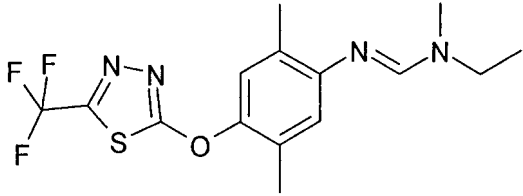
Table

Pyrenophora teres-test (barley) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 66		1000	22
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 2.5		1000	75

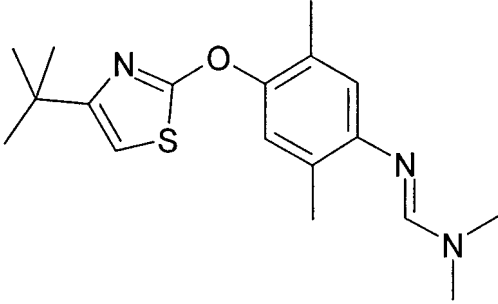
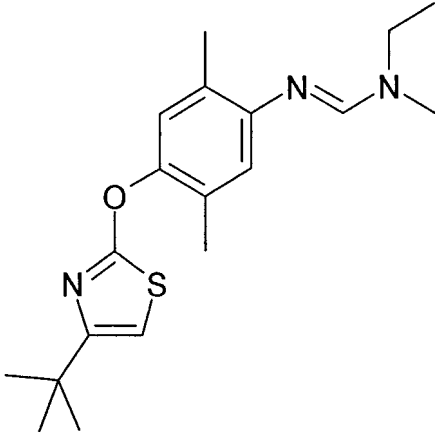
Table

Pyrenophora teres-test (barley) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 81		1000	43
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 3.2		1000	71

Table

Pyrenophora teres-test (barley) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 113		1000	63
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 1.75		1000	100

Example**Fusarium nivale (var. majus)-test (wheat) / preventive**

Solvent: 49 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.

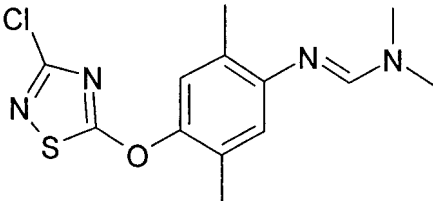
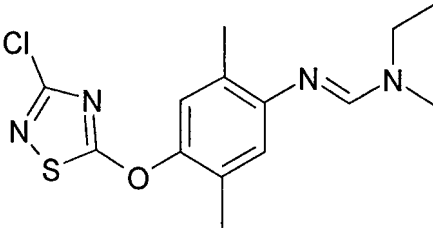
After the spray coating has been dried, the plants are slightly injured by using a sandblast and afterwards they are sprayed with a conidia suspension of *Fusarium nivale* (var. *majus*).

The plants are placed in the greenhouse under a translucent incubation cabinet at a temperature of approximately 10°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100%.

The test is evaluated 5 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

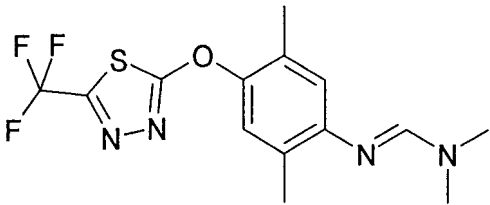
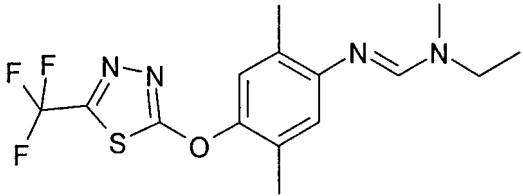
Table

Fusarium nivale (var. majus)-test (wheat) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 66		1000	0
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 2.5		1000	100

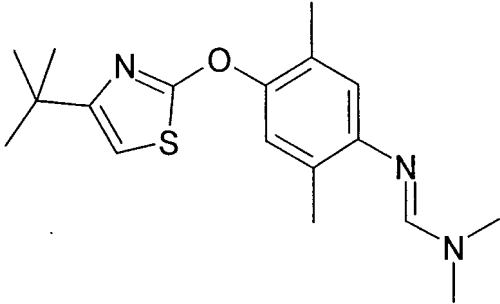
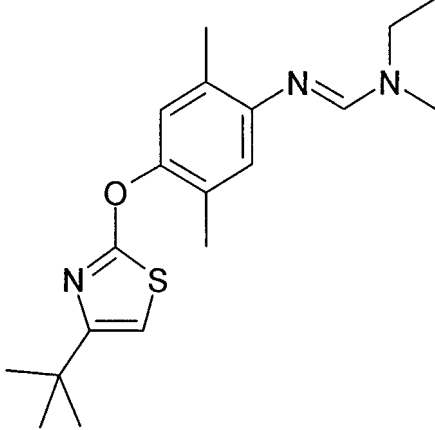
Table

Fusarium nivale (var. majus)-test (wheat) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 81		1000	43
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 3.2		1000	86

Table

Fusarium nivale (var. majus)-test (wheat) / preventive

	Active compound <u>Known from WO 2000/46184:</u>	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Ex. 113		1000	57
	<u>According to the invention:</u>		
Ex. 1.75		1000	100

DERIVADOS PLAGUICIDAS DE FENILAMIDINA SUSTITUIDA CON TIAZOLILOXI
DESCRIPCIÓN

La presente invención se refiere a derivados de fenilamidina sustituida con ariloxi, 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 o insectos dañinos fitopatógenos, especialmente de plantas, que usan estos compuestos o composiciones.

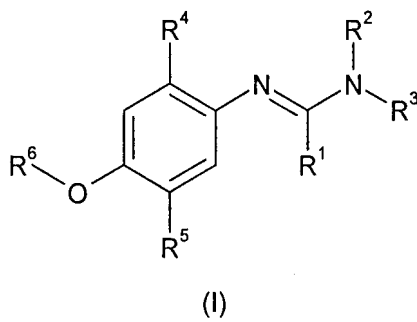
En la solicitud de patente internacional WO-00/46184 se describen varios derivados de fenilamidina. Sin embargo, este documento no describe o sugiere específicamente seleccionar tales compuestos en los que el anillo de fenilo está sustituido de acuerdo con la invención, permitiendo así una actividad 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 para controlar insectos dañinos u otros organismos dañinos.

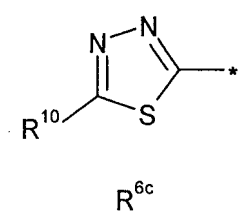
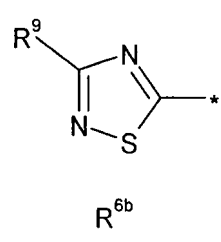
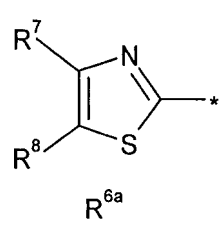
Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o ventajas anteriormente mencionados.

Por consiguiente, la presente invención provee derivados de amidina 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;
 - 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
 - R^1 y R^2 , R^1 y R^3 o R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo sustituido o no sustituido de 5 a 7 miembros;

- 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;
- 5 • R^6 representa un heterociclo seleccionado de la lista que consiste en



- R^7 representa H, halógeno, nitro, ciano; fenilo sustituido o no sustituido, bencilo sustituido o no sustituido; alquilo C_1-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , halógeno-alquilo C_1-C_6 , halógeno-alcoxi C_1-C_6 o halógeno-alquiltio C_1-C_6 ; alquilo $C_1-C_8-S(O)_mR^{11}$; alquilo $C_1-C_8-SO_2NR^{12}R^{13}$; alquilo $C_1-C_8-COR^{14}$; $-CR^{15}=N-O-R^{16}$, $S(O)_mR^{11}$, $SO_2NR^{12}R^{13}$, COR^{14} ;
- R^8 representa H, halógeno, ciano; fenilo sustituido o no sustituido, bencilo sustituido o no sustituido; alquilo C_1-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , halógeno-alquilo C_1-C_6 , halógeno-alcoxi C_1-C_6 o halógeno-alquiltio C_1-C_6 ; alquilo $C_1-C_8-COR^{14}$; $-CR^{15}=N-O-R^{16}$, COR^{14} ;
- R^7 y R^8 pueden formar un carbociclo, que puede ser saturado, insaturado o aromático y no sustituido o sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 o alcoxialquilo C_1-C_4 ;
- R^9 representa H, halógeno, ciano; fenilo sustituido o no sustituido, bencilo sustituido o no sustituido; alquilo C_1-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , halógeno-alquilo C_1-C_6 , halógeno-alcoxi C_1-C_6 o halógeno-alquiltio C_1-C_6 ; alquilo $C_1-C_8-COR^{14}$; $-CR^{15}=N-O-R^{16}$, COR^{14} ;
- 20 • R^{10} representa H, halógeno, ciano; fenilo sustituido o no sustituido, bencilo sustituido o no sustituido, piridilo sustituido o no sustituido; alquilo C_1-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , halógeno-alquilo C_1-C_6 , halógeno-alcoxi C_1-C_6 o halógeno-alquiltio C_1-C_6 ; alquilo $C_1-C_8-S(O)_mR^{11}$; alquilo $C_1-C_8-SO_2NR^{12}R^{13}$; alquilo $C_1-C_8-COR^{14}$; $-CR^{15}=N-O-R^{16}$, $S(O)_mR^{11}$, $SO_2NR^{12}R^{13}$, COR^{14} ;
- 25 • m representa 0, 1 ó 2;
- R^{11} representa alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 ;
- R^{12} representa H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 ;
- R^{13} representa H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 ;
- R^{14} representa H, alquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido, lineal o ramificado;
- 30 • R^{15} representa H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 ;
- R^{16} representa H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_8 , bencilo sustituido o no sustituido;
- R^{12} y R^{13} pueden formar un heterociclo de 5 ó 6 miembros, que puede además comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S;

- R^{15} y R^{16} pueden formar un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, incluyendo otros heteroátomos, como O, S, N; 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
- 10 las proporciones. Pueden separarse los diaestereoisómeros y/o los isómeros ópticos de 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.
- 15 Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las posibles 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.
- Para los compuestos según la invención, halógeno significa uno de flúor, bromo, cloro o
- 20 yodo y heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre.
- Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^1 representa H; alquilo C_1-C_{12} , preferiblemente alquilo C_1-C_{12} como metilo; o SH.
- Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^2 representa metilo.
- 25 Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^3 representa alquilo C_2-C_{12} , preferiblemente un alquilo C_2-C_4 no sustituido como etilo, n-propilo, i-propilo; alqueno C_2-C_{12} , preferiblemente alqueno C_3-C_4 como propenilo o alilo; cicloalquilo C_3-C_6 como ciclopropilo.
- Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los
- 30 que R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo sustituido o no sustituido de 5 a 7 miembros, preferentemente un heterociclo de 6 miembros, más preferentemente un piperidinilo o un pirolidinilo, incluso más preferentemente un pirolidinilo 2-alquilado como un 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
- 35 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 R^5 representa H, 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.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^7 representa H, Cl, Br, I, nitro, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , halógeno-alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alquiltio C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 -S(O) $_mR^{11}$; alquilo C_1-C_4 -SO $_2NR^{12}R^{13}$; alquilo C_1-C_4 -COR ^{14} ; -CR ^{15} =N-O-R ^{16} , S(O) $_mR^{11}$, SO $_2NR^{12}R^{13}$, COR ^{14} .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^8 representa H, Cl, Br, I, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , halógeno-alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alquiltio C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 -COR ^{14} ; -CR ^{15} =N-O-R ^{16} , COR ^{14} .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^7 y R^8 forman un carbociclo, que puede ser saturado, insaturado o aromático y sustituido o no sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 o alcóxialquilo C_1-C_4 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^9 representa H, Cl, Br, I, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alquilo C_1-C_4 ; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , halógeno-alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alquiltio C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 -COR ^{14} ; -CR ^{15} =N-O-R ^{16} , COR ^{14} .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{10} representa H, Cl, Br, I, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; piridilo; piridilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alcoxi C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , halógeno-alquilo C_1-C_4 , halógeno-alcoxi C_1-C_4 o halógeno-alquiltio C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 -S(O) $_mR^{11}$; alquilo C_1-C_4 -SO $_2NR^{12}R^{13}$; alquilo C_1-C_4 -COR ^{14} ; -CR ^{15} =N-O-R ^{16} , S(O) $_mR^{11}$, SO $_2NR^{12}R^{13}$, COR ^{14} .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{11} representa alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{12} representa H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{13} representa H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 .

Incluso otros compuestos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{14} representa H, alquilo C_1-C_8 lineal o ramificado, alcoxi C_1-C_8 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R¹⁵ representa H, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R¹⁶ representa H, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, bencilo; bencilo sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄ o halógeno-alquilo C₁-C₄.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R¹² y R¹³ forman un heterociclo de 5 ó 6 miembros, que puede además comprender uno o más heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en O, N, S.

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R¹⁵ y R¹⁶ pueden formar un heterociclo de 5 ó 6 miembros que comprende otros heteroátomos, como O, S, N.

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.

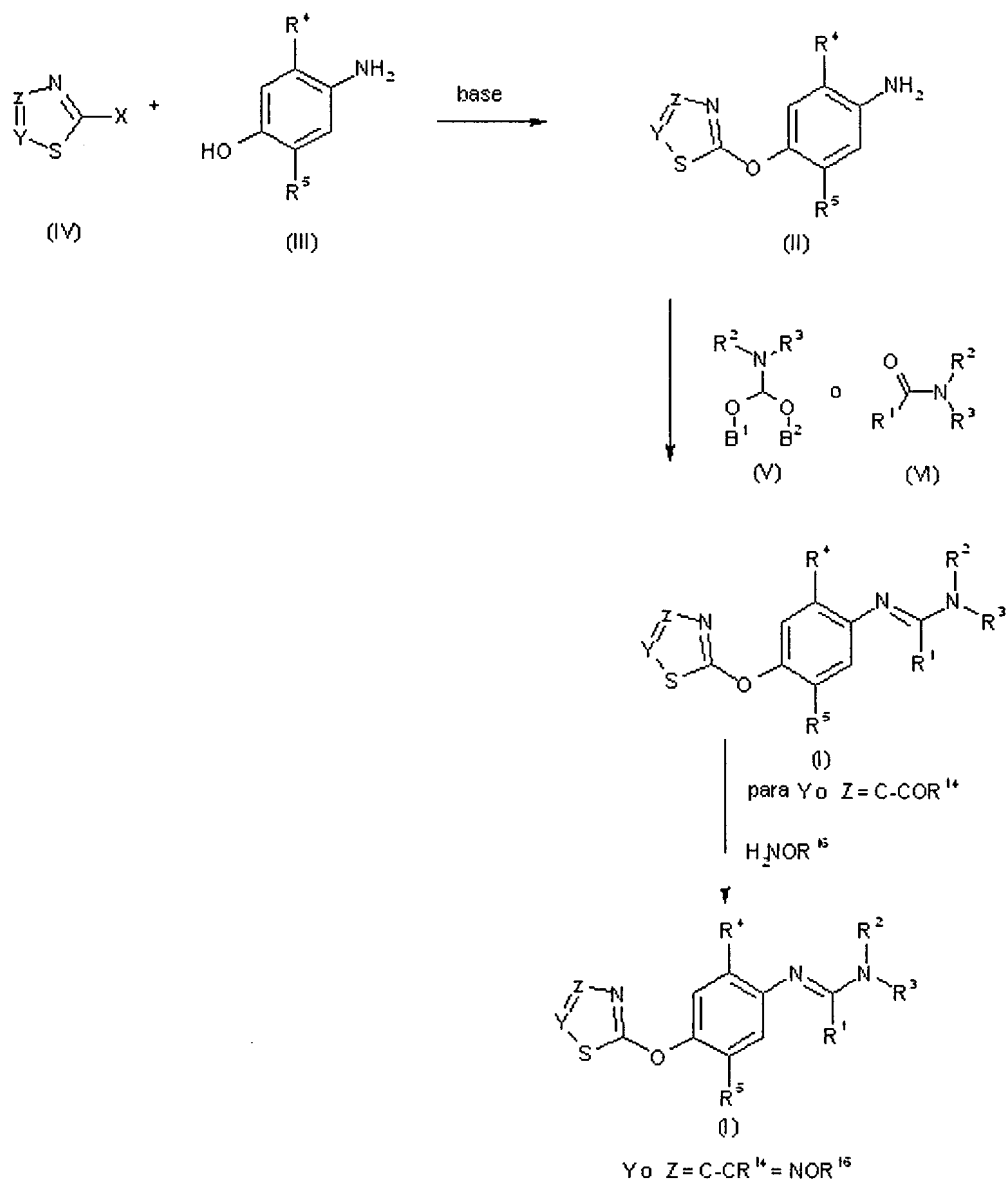
Ejemplos de tales subclases de compuestos preferidos según la invención pueden combinar:

- características preferidas de R¹ con características preferidas de R² a R⁶ o a R¹⁶ si corresponde;
- características preferidas de R² con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹⁶ si corresponde;
- características preferidas de R³ con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹⁶ si corresponde;
- características preferidas de R⁴ con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹⁶ si corresponde;
- características preferidas de R⁵ con características preferidas de R¹ a R⁶ o a R¹⁶ si corresponde.

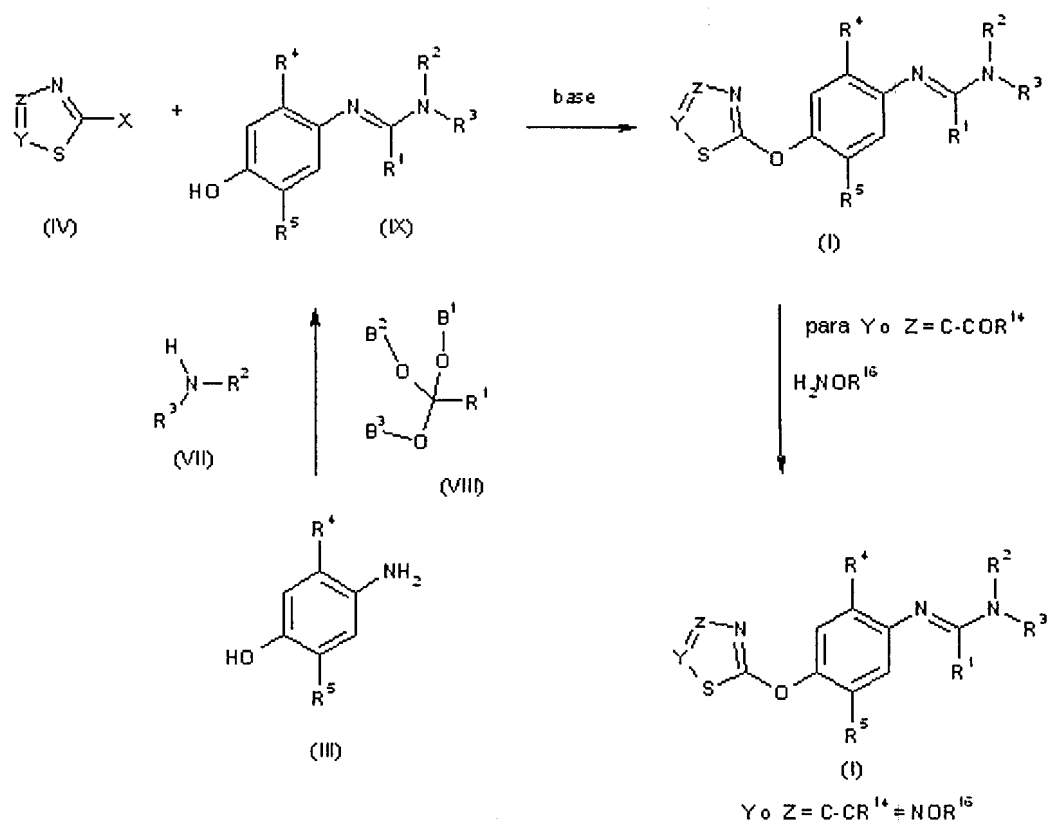
En estas combinaciones de características preferidas de los sustituyentes de los compuestos según la invención, dichas características preferidas también se pueden seleccionar entre las características más preferidas de m, n y R¹ a R¹¹ como para formar las subclases más preferidas de los compuestos según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

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) según la invención se puede llevar a cabo tal como se ilustra en el esquema 1 y en el esquema 1a.

6

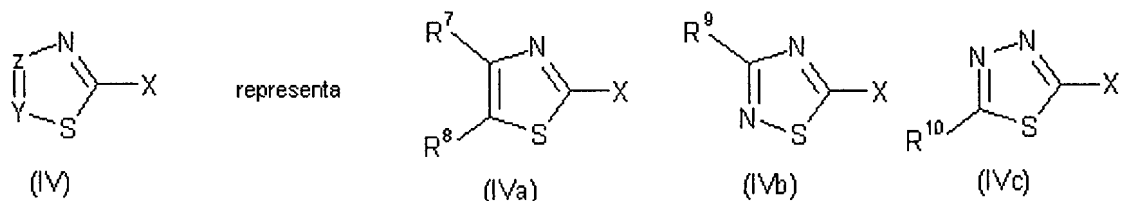


Esquema 1



Esquema 1a

En los esquemas 1 y 1a, fórmula (IV)



5

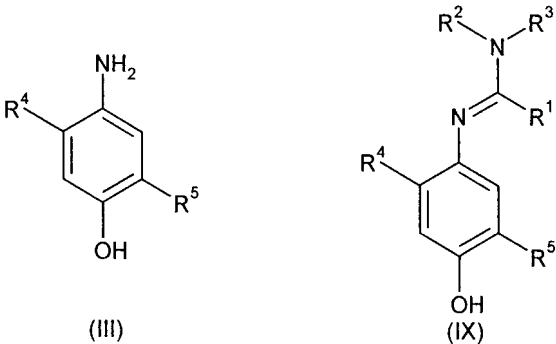
en las que

- Y representa C-R⁸ (véase fórmula (IVa)), C-R¹⁰ (véase fórmula (IVc)) o N (véase fórmula (IVb)),
- Z representa C-R⁷ (véase fórmula (IVa)), C-R⁹ (véase fórmula (IVb)) o N (véase fórmula (IVc)).
- R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son tal como se definen en la presente memoria,
- X representa halógeno, triflato, SOMe, mesilato o tosilato.

10

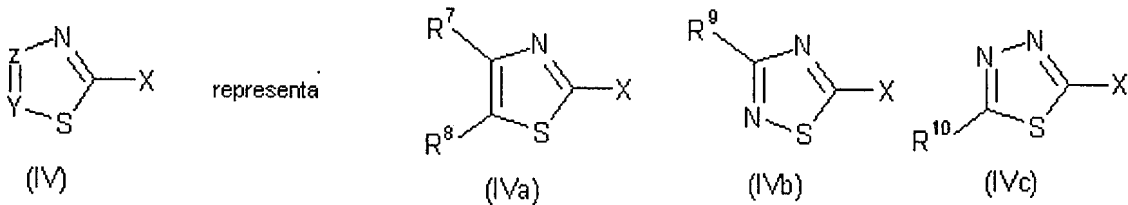
Por lo tanto, según otro aspecto de la invención, se provee un procedimiento (a) para la preparación de derivados de anilina de fórmulas (I) y (II), haciendo reaccionar derivados de aminofenol de fórmula (III) o derivados de amidina de fórmula (IX)

15



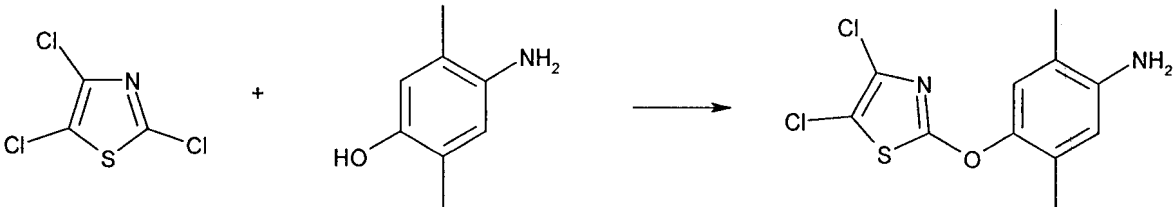
en las que

- R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son tal como se definen en la presente memoria,
- con derivados de triazol o derivados de tiadiazol (1,3,4-tiadiazoles o 1,3,5-tiadiazoles) de
- 5 fórmula (IV) o (IVa), (IVb) y (IVc), respectivamente,



en las que

- Z, Y, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son tal como se definen en la presente memoria
 - X representa halógeno, triflato, SOME, mesilato o tosilato.
- 10 El procedimiento (a) según la invención puede además comprender una o más de las siguientes características:
- presencia de una base;
 - presencia de un diluyente orgánico inerte;
 - presencia de un catalizador.
- 15 El procedimiento (a) según la invención se lleva a cabo usando 4-amino-2,5-dimetilfenol, 2,4,5-tricloro-1,3-tiazol y una base como materiales de partida. El procedimiento (a) se puede llevar a cabo según el esquema 2.



Esquema 2

20

La fórmula (IV) o las fórmulas (IVa), (IVb) y (IVc), respectivamente, proveen las definiciones generales para los derivados de triazol y derivados de tiadiazol útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (a) según la invención.

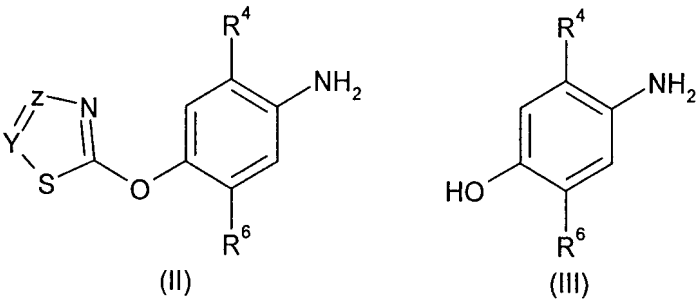
Las fórmulas (III) y (IX) proveen una definición general de los derivados de aminofenol o

25 derivados de amidina útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (a)

según la invención. En esta fórmula, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, X, Y y Z preferiblemente representan sustituyentes tal como se definen en la presente memoria en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

Los derivados de amidina de fórmula (I) y (IX) se pueden preparar por un procedimiento adicional según la invención. Se pueden considerar las distintas alternativas del procedimiento (b) según la invención, se definen como procedimiento (b1), procedimiento (b2) y procedimiento (b3) según la invención.

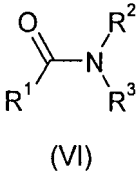
El procedimiento (b) según la invención comprende hacer reaccionar derivados de anilina de fórmulas (II) y (III) con diferentes reactivos, definiendo así los procedimientos (b1), (b2) y (3) respectivamente



en las que

- R⁴, R⁶, Y y Z son tal como se definen en la presente memoria.

El procedimiento (b1) se lleva a cabo usando además los derivados de amida de fórmula (VI)



en la que

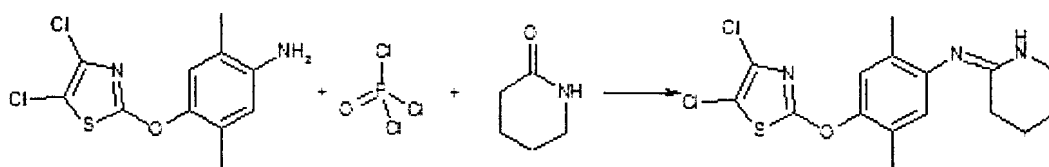
- R¹, R², R³ son tal como se definen en la presente memoria.

El procedimiento (b1) según la invención puede además comprender una o más de las siguientes características:

- presencia de un agente de halogenación como PCl₅, PCl₃, POCl₃, SOCl₂;
- presencia de un diluyente.

El procedimiento (b1) según la invención se lleva a cabo usando 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina, piperidin-2-ona y tricloruro fosfórico como materiales de partida. El procedimiento (b1) se puede llevar a cabo según el esquema 3.

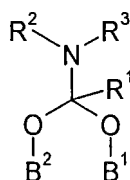
10



Esquema 3

La fórmula (II) provee una definición general de los derivados de bifenilamina útiles como
 5 materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (b1) según la invención. En esta
 fórmula R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , Y y Z preferiblemente representan sustituyentes
 tales como los definidos en la presente memoria en relación con la descripción de los
 compuestos de fórmula (I) según la invención.

El procedimiento (b2) se lleva a cabo usando además derivados de amino-acetal de
 10 fórmula (V)



(V)

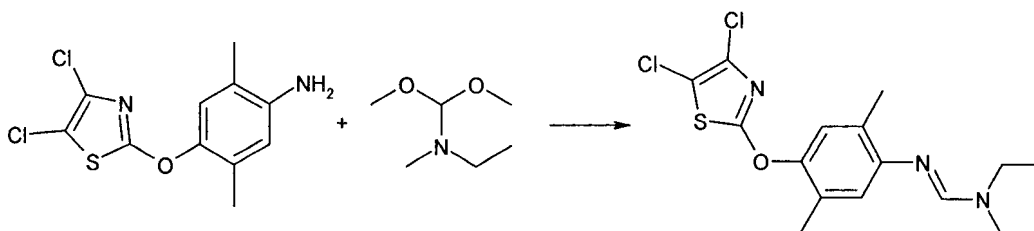
en la que

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

El procedimiento (b2) según la invención puede además comprender una o más de las
 siguientes características:

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

El procedimiento (b2) según la invención se lleva a cabo usando 4-[(4,5-dicloro-1,3-
 20 tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina y N-(dimetoximetil)-N-metiletanamina como materiales de
 partida. El procedimiento (b2) se puede llevar a cabo según el esquema 4.

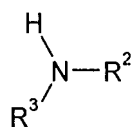


Esquema 4

25

El procedimiento (b3) se lleva a cabo usando además derivados de amina de fórmula
 (VII)

11

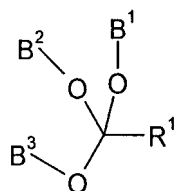


(VII)

en la que

- R^2 y R^3 son tal como se definen en la presente memoria;

5 en presencia de derivados de ortoéster de fórmula (VIII)



(VIII)

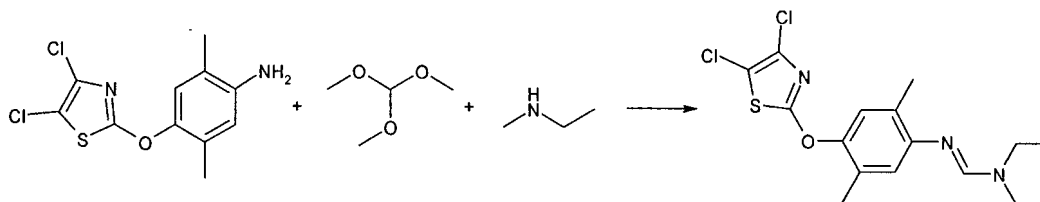
en la que

- R^1 es como se define en la presente memoria;
- 10 • B^1 , B^2 y B^3 representan cada uno alquilo.

Las fórmulas (II) y (III) proveen definiciones generales de los derivados de amina útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (b3) según la invención. En estas fórmulas R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , Y y Z preferiblemente representan sustituyentes tales como los definidos en la presente memoria en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

El procedimiento (b3) según la invención se lleva a cabo usando 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina, 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

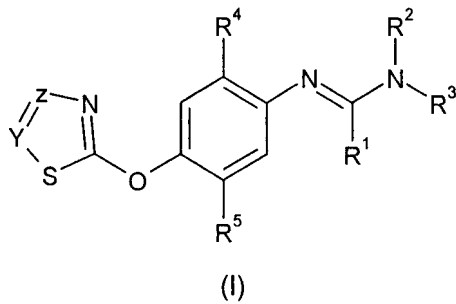
Las fórmulas (II) y (III) proveen definiciones generales de los derivados de amina útiles como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (b3) según la invención. En estas fórmulas R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , Y y Z preferiblemente representan sustituyentes tales como los definidos en la presente memoria en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

Los procedimientos (b), (b1), (b2) o (b3) según la invención pueden además comprender una o más de las siguientes características:

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

Los derivados de amidina de fórmula (I) pueden prepararse mediante un procedimiento adicional (c) según la invención, haciendo reaccionar derivados de amidina de fórmula (I)

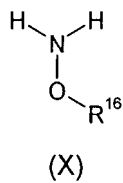
5



en la que

- Y o Z representan C-COR₁₄ y R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son tal como se definen en la presente memoria con hidroxilaminas o sus sales, respectivamente

10



en la que R¹⁶ es tal como se define en la presente memoria.

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

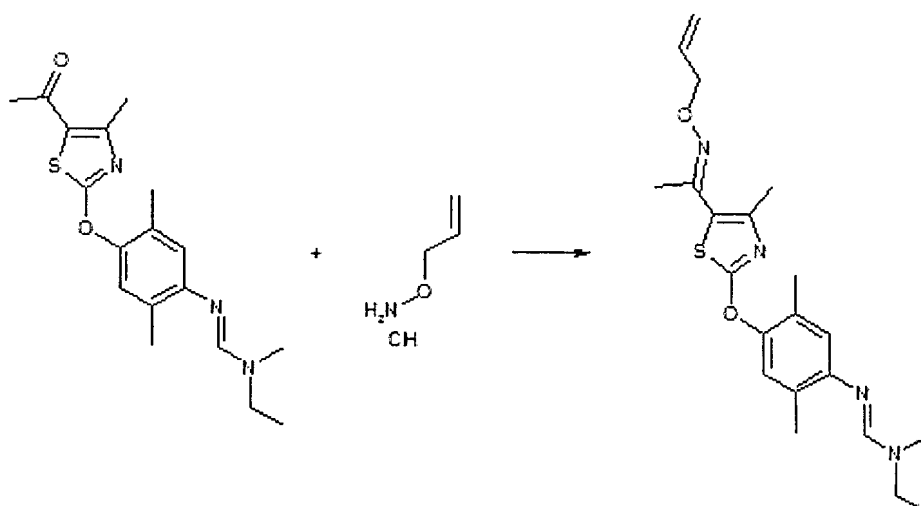
15

- presencia de un ácido o de una base;
- presencia de un diluyente orgánico inerte;
- presencia de un catalizador.

El procedimiento (c) según la invención se lleva a cabo usando hidrocloreuro de N'-{4-[(5-acetil-4-metil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida y 3-(aminooxi)prop-1-eno como materiales de partida.

20

El procedimiento (c) se puede llevar a cabo según el esquema 6.



Esquema 6

Los diluyentes adecuados para llevar a cabo el procedimiento (a) según la invención son
 5 todos 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; hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butílico, éter metil
 10 metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-di-etoxietano 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.

Los diluyentes adecuados para llevar a cabo el procedimiento (b1), (b2), (b3) y (c) según
 15 la invención son, en cada caso, todos disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso de hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metil-ciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalin; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butílico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-di-etoxietano o anisol; nitrilos, tales
 20 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 dimetilsulfóxido; 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, metoxi-
 25 etanol, dietilenglicol-monometiléter, dietilenglicolmonoetiléter; sus mezclas con agua o agua pura.

Las bases adecuadas para llevar a cabo el procedimiento (a) según la invención son todos bases orgánicas e inorgánicas habituales para dichas 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, diisoproilamida 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).

Los ácidos adecuados para llevar a cabo el procedimiento (b3) según la invención son todos ácidos inorgánicos y 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 (b1) según la 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 N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensadores habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxycarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), triphenilfosfina/tetraclorometano, o bromotripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato.

Cuando se llevan a cabo los procedimientos (a), (b) y (c) 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.

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 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).

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 según la invención.

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

Así, según la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (I), como se define en la presente memoria, y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el
10 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
15 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
20 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
25 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
30 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,
35 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), 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 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 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:

B1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis del ácido nucleico como benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, quiralaxilo, clozilacón, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico;

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

B3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo como inhibidor de la respiración-CI como diflumentorim;

como inhibidor de la respiración CII como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida;

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;
- B6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de AA y proteínas como andoprim, blasticidina-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloreuro de kasugamicina hidratada, mepanipirim, pirimetanil;
- B7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señal como fenciclonil, fludioxonil, quinoxifen;
- B8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membranas como clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano, tolclofos-metilo, bifenilo, yodocarb, propamocarb, propamocarb-hidrocloreuro;
- 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;
- 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;
- B12) un compuesto capaz de inducir una defensa del hospedador como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil;
- 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, oxicloruro 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, mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, tiram, toliifluanid, 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, nitotal-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, triclámida, 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-
 5 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]-
 10 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-
 15 dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-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-feniletil)oxi]fenil]etilideno]amino]oxi]metil]-.alfa.-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-bencenoacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-
 20 (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-carboxílico.

La composición según la invención que comprende una mezcla de un compuesto de
 25 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, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

30 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
 35 la invención a la semilla o al fruto 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 al fruto de la planta o al suelo en el que crece o se desea que crezca la planta.

- 5 El método de tratamiento según la invención puede también ser útil para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o siembras de plántulas y plantas o siembras de plantas. Este procedimiento de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El método de tratamiento según la invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o vástagos, hojas, flores y
- 10 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.,

15 *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.

20 (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 cacahuètes), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y arbóreos; así

25 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*;

- 30 Enfermedades por *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*;

Enfermedades por roya, tales como:

Enfermedades por *Gymnosporangium*, causadas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;

- 35 Enfermedades por *Hemileia*, causadas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;

Enfermedades por *Phakopsora*, causadas por ejemplo por *Phakopsora pachyrhizi* o *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*;
- Enfermedades por Peronospora, causadas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
- Enfermedades por Phytophthora, causadas por ejemplo por *Phytophthora infestans*;
- 5 Enfermedades por Plasmopara, causadas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;
- Enfermedades por Pseudoperonospora, provocadas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudo-pero-no-spora cubensis*;
- Enfermedades por Pythium, causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;
- Enfermedades por manchas foliares, rojeces foliares, tizón foliar tales como:
- 10 Enfermedades por Alternaria, causadas por ejemplo por *Alternaria solani*;
- Enfermedades por Cercospora, causadas por ejemplo por *Cercospora beticola*;
- Enfermedades por Cladosporium, causadas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;
- Enfermedades por Cochliobolus, causadas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;
- Enfermedades por Colletotrichum, causadas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthianum*;
- 15 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*;
- Enfermedades por Glomerella, causadas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;
- 20 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*;
- 25 *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;
- Enfermedades por Phaeosphaeria, causadas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum*;
- Enfermedades por Pyrenophora, causadas por ejemplo por *Pyrenophora teres*;
- Enfermedades por Ramularia, provocadas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni*;
- Enfermedades por Rhynchosporium, causadas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;
- 30 Enfermedades por Septoria, causadas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;
- Enfermedades por Typhula, causadas por ejemplo por *Typhula incarnata*;
- 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*;
- 35 Enfermedades por Fusarium, causadas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;
- 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:

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.* ;

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

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

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

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

Enfermedades por Carbón y tizón, tales como:

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

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

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

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

Enfermedades por moho y roña de la fruta tales como:

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

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

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

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

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

20 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*;

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

Enfermedades por *Sclerotium*, causadas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;

Enfermedades por *Microdochium*, causadas por ejemplo por *Microdochium nivale*;

Enfermedades por cancro, escoba, puntisecho tales como:

Enfermedades por *Nectria*, causadas por ejemplo por *Nectria galligena*;

30 Enfermedades por tizón, tales como :

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:

35 Enfermedades por Esca, causadas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;

Eutypa dyebae, causada por ejemplo por *Eutypa lata*;

Enfermedad de los olmos holandeses (Dutch elm), causada por ejemplo por *Ceratocystis ulmi*;

Enfermedades de flores y semillas tales como:

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

Enfermedades de tubérculos tales como:

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

- 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, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *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., *Brevi-palpus* 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., *Ornitho-doros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllo-coptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psorop-tes* 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, *Acanthosce-lides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solsti-tialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Antho-nomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceutho-rhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Cono-derus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zea-landica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllo-ides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorphia elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypo-thenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lisso-rhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meli-gethes aeneus*, *Melolontha melo-lontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus holo-leucus*, *Oryctes rhino-ceros*, *Oryzae-philus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premno-trypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogo-derma* 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 anthropo-phaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Droso-phila*

- spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyp-po-bosca* spp., *Hypo-derma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Os-cinella* frit, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp;
- 5 • 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*
- 10 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*,
- 15 *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.,
- 20 *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eury-gaster* 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*,
- 25 *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;
- la clase de *Homoptera*, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* 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*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*,
- 30 *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calli-gypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Cero-plastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cocomytilus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp.,
- 35 *Empoasca* spp., *Erio-soma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalo-disca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idio-scopus* spp., *Lao-delphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macro-siphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Met-calfiella* spp., *Meto-polophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., *Naso-novia ribisnigri*, *Nephotettix* spp.,

- Nilaparvata lugens*, *Onco-metopia* spp., *Orthezia prae-longa*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Pere-grinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phyllo-xera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Prot-pulvinaria pyriformis*, *Pseudauleacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopa-losiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Sticto-cephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxo-ptera* spp., *Tri-aleurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*;
- 5 • la clase de *Hymenoptera*, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hop-locampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.;
- la clase de *Isopoda*, por ejemplo, *Arma-dillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Por-cellio scaber*;
- la clase de *Isoptera*, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.;
- 15 • la clase de *Lepidoptera*, por ejemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Buccu-latrix thur-beriella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia po-dana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomo-nella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumi-ferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalo-cerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehnel-la*, *Euproctis chrysorr-hoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*,
- 20 *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Ho-f-manno-phila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *La-phygma* spp., *Litho-colletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mame-stra brassicae*, *Mocis repanda*, *My-thimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylo-stella*, *Prodenia* spp., *Pseu-daletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodop-tera* spp., *Thermesia gemmatalis*,
- 25 *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Tricho-plusia* spp.;
- la clase de *Orthoptera*, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leuco-phaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*;
- 30 • la clase de *Siphonaptera*, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheo-pis*.
- la clase de *Symphyla*, por ejemplo, *Scutigera* spp.;
- 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.;
- 35 • la clase de *Thysanura*, por ejemplo, *Lepisma saccharina*;
- los nemátodos fitoparasitarios que incluyen por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globo-dera* spp., *Helicotylenchus* 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*,
5 *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*;
 - Hymenopterons, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*,
10 *Urocerus augur*;
 - termitas, tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*;
 - Bristletails, tales como *Lepisma saccharina*;
 - 15 • 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 farinae*;
 - la clase de *Araneae*, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*;
 - 20 • la clase de *Opiliones*, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;
 - la clase de *Isopoda*, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
 - la clase de *Diplopoda*, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*;
 - la clase de *Chilopoda*, por ejemplo, *Geophilus spp.*;
 - 25 • la clase de *Zygentoma*, por ejemplo, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*;
 - 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*;
 - 30 • la clase de *Saltatoria*, por ejemplo, *Acheta domesticus*;
 - la clase de *Dermaptera*, por ejemplo, *Forficula auricularia*;
 - la clase de *Isoptera*, por ejemplo, *Kaloterms spp.*, *Reticuliterms spp.*;
 - la clase de *Psocoptera*, por ejemplo, *Lepinatus spp.*, *Liposcelis spp.*;
 - la clase de *Coleoptera*, por ejemplo, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Dermestes spp.*;
 - 35 *Latheticus oryzae*, *Necrobia spp.*, *Ptinus spp.*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
 - la clase de *Diptera*, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex*

quinquefasciatus, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;

- 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*, *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 según la invención también se puede usar 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 según la invención se pueden usar también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas humanas o animales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades por *Trichophyton* y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.
- 5 Los diversos aspectos de la invención se ilustrarán ahora con relación a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. 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.
- 10 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:
- 15 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 llevó a cabo usando alcan-2-onas lineal (que comprende 3 a 16 átomos de carbono) con valores logP conocidos (determinación de los valores logP por los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).
- 20 Los valores máx de lambda se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 190nm a 400nm.

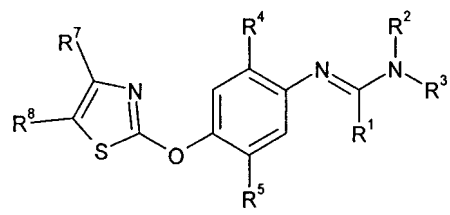


Tabla 1:

No	R2	R3	R1	R4	R5	R7	R8	log p (HCO OH)
1.1	Me	Et	H	Me	Me	Cl	Cl	2,12
1.2	Me	Et	H	Me	Me	-CH=CH-C(Cl)=CH-		2,29
1.3	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	Cl	2,18
1.4	Me	Et	H	Me	Me	tBu	Cl	2,76
1.5	Me	Et	H	Me	Me	CF3	Cl	2,15
1.6	Me	Et	H	Me	Me	Cl	Br	2,00
1.7	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	Cl	2,23
1.8	Me	Et	H	Me	Me	-CH=CH-CH=CH-		1,89
1.9	Me	iPr	H	Me	Me	iPr	Cl	2,57
1.10	Me	iPr	H	Me	Me	CF3	Cl	2,29
1.11	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	Br	2,22
1.12	Me	Et	H	Me	Me	Me	Cl	1,96
1.13	Me	iPr	H	Me	Me	Me	Cl	2,14
1.14	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	H	1,70
1.15	Me	n-Pr	H	Me	Me	-CH=CH-C(Cl)=CH-		2,46
1.16	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NO-t-Bu	2,80
1.17	Me	Et	H	Me	Me	Cl	Me	1,80
1.18	Me	Et	H	Me	Me	Cl	H	1,60
1.19	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NOMe	1,97
1.20	Me	Et	H	Me	Me	iPr	Cl	2,52
1.21	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NO-CH2CH=CH2	2,33
1.22	-CH2CH2CH2CH2CH(CH3)-		H	Me	Me	Cl	Cl	2,44
1.23	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	Me	1,94
1.24	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NOCH(Me)Ph	2,87
1.25	H	-CH2CH2CH2CH2CH2-		Me	Me	Cl	Cl	1,97
1.26	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	Cl	2,12
1.27	Me	Et	H	Me	Me	Me	Ac	1,50
1.28	Me	iPr	H	Me	H	Cl	Cl	2,09
1.29	Me	n-Pr	H	Me	Me	-CH=CH-CH=CH-		2,04
1.30	-CH2CH2-O-CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	Cl	1,95
1.31	Me	Me	H	Me	Me	Cl	Me	1,69
1.32	H	-CH2CH2CH2CH2-		Me	Me	Cl	Cl	1,93
1.33	Me	Et	H	Me	H	Me	Me	1,65
1.34	Me	iPr	H	Me	H	Me	Me	1,66
1.35	Me	iPr	H	Me	Me	Me	nPr	2,29
1.36	Me	Et	H	Me	Me	Me	nPr	2,22
1.37	Me	iPr	H	Me	Me	Me	Me	1,98
1.38	Me	Et	H	Me	Me	Me	Me	1,87
1.39	Me	Et	H	Me	H	Cl	Cl	1,99
1.40	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NOH	1,55
1.41	Me	iPr	H	Me	Me	Me	CMe=NOH	1,66
1.42	Me	Et	H	Me	Me	CHO	Cl	1,46
1.43	Me	Et	H	Me	Me	CH=NOMe	Cl	1,93
1.44	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-t-Bu	Cl	2,65
1.45	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2CH=CH2	Cl	2,26
1.46	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-Et	Cl	2,17
1.47	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-Ph	Cl	2,51
1.48	Me	Et	H	Me	Me	CMe=NOCH(Me)Ph	Cl	2,75
1.49	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(4-t-Bu)-Ph	Cl	3,46
1.50	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(4-NO2)-Ph	Cl	2,60
1.51	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(3-Me)-Ph	Cl	2,84
1.52	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(3-Cl)-Ph	Cl	2,86
1.53	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(4-CF3)-Ph	Cl	3,01
1.54	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(3-CF3)-Ph	Cl	2,97
1.55	Me	Et	H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph	2,80
1.56	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph	3,00
1.57	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CH=NOMe	2,04
1.58	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CH=NO-CH2CH=CH2	2,32
1.59	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CH=NO-CH2-Ph	2,64
1.60	Me	Et	H	Me	Me	Ph	H	2,18
1.61	Me	iPr	H	Me	Me	Ph	H	2,25
1.62	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CHO	1,68

No	R2	R3	R1	R4	R5	R7	R8	log p (HCOOH)
1.63	Me	Et	H	Me	Me	CH=NOH	Cl	1,53
1.64	Me	iPr	H	Me	Me	tBu	Cl	2,79
1.65	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	tBu	Cl	3,05
1.66	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph	2,97
1.67	Me	Et	H	Me	Me	-CCI=CH-CH=CH		2,17
1.68	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	-CCI=CH-CH=CH		2,34
1.69	Me	nPr	H	Me	Me	-CCI=CH-CH=CH		2,29
1.70	Me	iPr	H	Me	Me	-CCI=CH-CH=CH		2,40
1.71	Me	Et	H	Me	Me	tBu	Br	2,78
1.72	Me	Et	H	Me	Me	CN	Cl	1,74
1.73	Me	Et	H	Me	Me	Cl	tBu	2,87
1.74	Me	Et	H	Me	Me	H	tBu	2,18
1.75	Me	Et	H	Me	Me	tBu	H	2,26

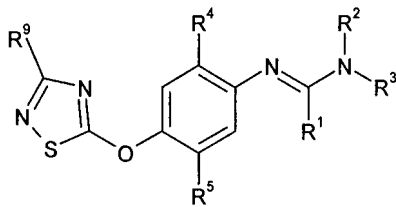


Tabla 2:

No	R1	R2	R3	R4	R5	R9	logP (HCOOH)
2.1	H	Me	i-Pr	Me	H	i-Pr	1,77
2.2	H	Me	Et	Me	H	i-Pr	1,57
2.3	H	Me	Et	Me	Me	i-Pr	1,74
2.4	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr	1,89
2.5	H	Me	Et	Me	Me	Cl	1,56
2.6	H	Me	i-Pr	Me	Me	Cl	1,67
2.7	H	Me	Et	Me	H	t-Bu	2,04

5

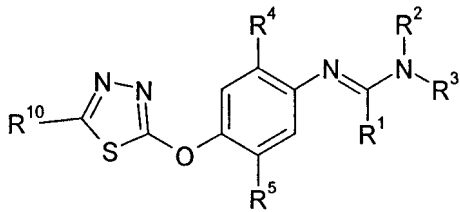


Tabla 3:

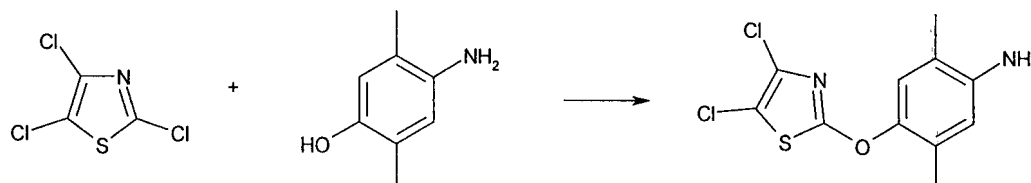
No	R1	R2	R3	R4	R5	R10	logP (HCOOH)
3.1	H	Me	i-Pr	Me	Me	CF3	1,84
3.2	H	Me	Et	Me	Me	CF3	1,78
3.3	H	Me	Et	Me	Me	Ph	1,93
3.4	H	Me	Et	Me	Me	2-F-6-OMe-Ph	1,87

3.5	H	Me	Et	Me	Me	2-F-Ph	1,98
3.6	H	Me	i-Pr	Me	Me	Ph	2,00
3.7	H	Me	Et	Me	Me	3-F-4-F-Ph	2,08
3.8	H	Me	Et	Me	Me	4-OCF ₃ -Ph	2,35
3.9	H	Me	i-Pr	Me	Me	4-OCF ₃ -Ph	2,48
3.10	H	Me	Et	Me	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	2,33
3.11	H	Me	i-Pr	Me	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	2,43
3.12	H	Me	Et	Me	Me	4-SO ₂ Me-Ph	1,52
3.13	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-F-4-F-Ph	2,28
3.14	H	Me	i-Pr	Me	Me	2-F-Ph	2,22
3.15	H	Me	i-Pr	Me	Me	2-F-6-OMe-Ph	2,11
3.16	H	Me	i-Pr	Me	Me	4-SO ₂ Me-Ph	1,69
3.17	H	Me	i-Pr	Me	Me	2-Cl-Ph	2,11
3.18	H	Me	i-Pr	Me	Me	SMe	1,82
3.19	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr	1,69
3.20	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl-Ph	2,05
3.21	H	Me	Et	Me	Me	SMe	1,69
3.22	H	Me	Et	Me	Me	i-Pr	1,61
3.23	H	Me	Et	Me	Me	ciclo-Pr	1,50
3.24	H	Me	Et	Me	Me	3-Cl-4-F-Ph	2,13
3.25	H	Me	i-Pr	Me	Me	4-MeO-Ph	2,02
3.26	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-MeO-Ph	2,06
3.27	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-Me-Ph	2,12
3.28	H	Me	Et	Me	Me	4-NO ₂ -Ph	1,92
3.29	H	Me	Et	Me	Me	4-MeO-Ph	1,93
3.30	H	Me	Et	Me	Me	3-MeO-Ph	2,02
3.31	H	Me	Et	Me	Me	3-Me-Ph	2,06
3.32	H	Me	i-Pr	Me	Me	ciclo-Pr	1,57
3.33	H	Me	i-Pr	Me	Me	4-NO ₂ -Ph	2,05
3.34	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-Cl-4-F-Ph	2,27
3.35	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	4-OCF ₃ -Ph	2,64
3.36	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	2,61
3.37	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	3-Me-Ph	2,21
3.38	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	2-F-Ph	2,19
3.39	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	2-Cl-Ph	2,21
3.40	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	SMe	1,89
3.41	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	i-Pr	1,73
3.42	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	Me	3-Cl-4-F-Ph	2,43

3.43	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	ciclo-Pr	1,65
3.44	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	Me	Me	CF ₃	1,59

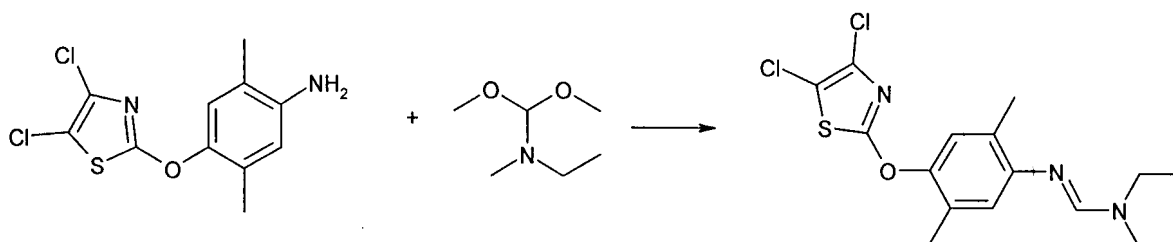
Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitativa la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

Ejemplo de preparación 1 - Procedimiento (a) – compuesto (IV) a compuesto (II): 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina - intermedio (II-1)



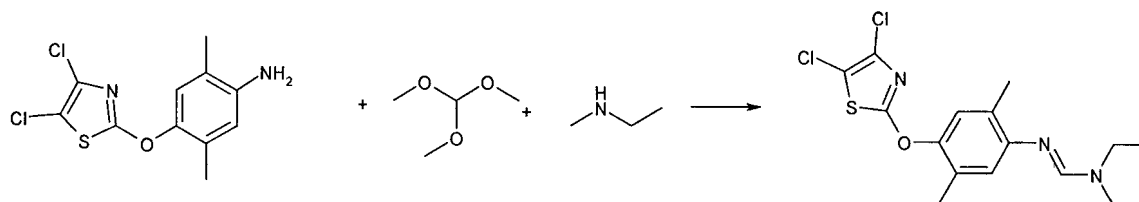
Se añadieron 1,3 g (33 mmol) (60% en aceite) en porciones a una disolución de 4,1 g (30,0 mmol) de 4-amino-2,5-dimetilfenol en 30 ml de dimetilformamida. Después de que cesó la evolución gaseosa, se añadieron 5,6 g (30 mmol) de 2,4,5-tricloro-1,3-tiazol y la mezcla de reacción se agitó durante 1 h a 100 °C. A temperatura ambiente, se añadieron 0,5 ml de metanol, 10 ml de agua y 100 ml de acetato de etilo sucesivamente. La capa orgánica se separó, la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio. La concentración *in vacuo* y la cromatografía en columna (éter de petróleo / acetona 4/1) produjeron 4,8 g (16,6 mmol, 55%) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina log P (pH = 2,3) = 3,4

Ejemplo de preparación 2 - Procedimiento (b2) - compuesto (II) a compuesto (I): N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida – compuesto 1.1



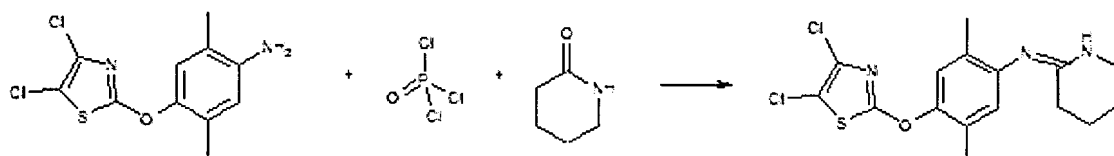
A una mezcla de 2,0 g (6,9 mmol) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina en 2,5 ml tolueno, se le añadió una disolución de 9,7 mmol en N-(dimetoximetil)-N-metiletanamina (60% en metanol). La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a 105 °C. La mezcla de reacción se concentró *in vacuo*. La cromatografía en columna (gradiente: ciclohexano -> acetato de etilo) produjo 2,4 g (6,7 mmol) 97% de N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 2,04

Ejemplo de preparación 3 - Procedimiento (b3) - compuesto (II) a compuesto (I): N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida – compuesto 1.1



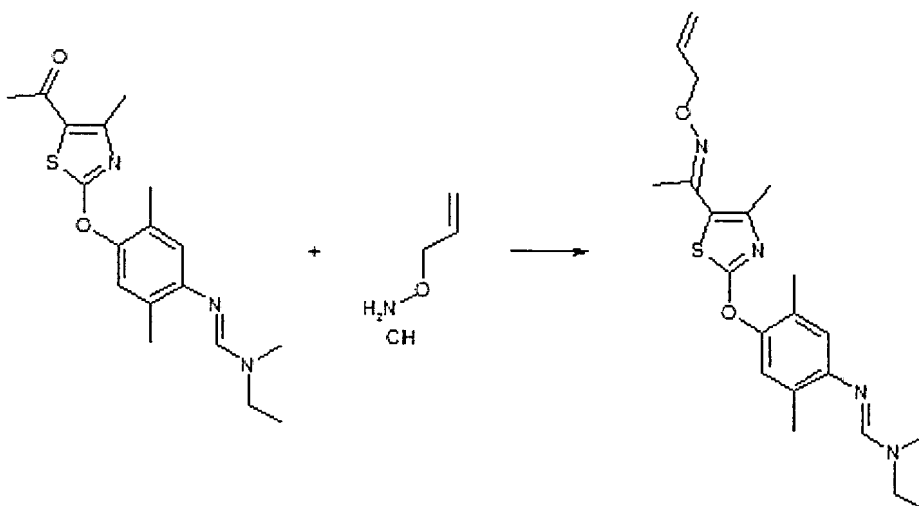
A una mezcla de 2,0 g (6,9 mmol) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina y 11,3 ml (0,13 mol) de trimetoximetano se le añadieron 0,12 g (0,7 mmol) de ácido p-tolueno sulfónico. La mezcla de reacción se sometió a reflujo durante 16 horas y se concentró *in vacuo*. El producto bruto se disolvió en 12 ml de tolueno y se añadieron 0,82 g (13,8 mmol) de N-metiletanamina. La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a 50 °C. La mezcla de reacción se concentró *in vacuo*. La cromatografía en columna (gradiente: éter de petróleo -> éter metil-terc. butílico) produjo 2,3 g (6,3 mmol) 91% de N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 2,04

Ejemplo de preparación 4 - Procedimiento (b1) - compuesto (II) a compuesto (I): 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetil-N-[piperidin-2-lideno]anilina – compuesto 1.25



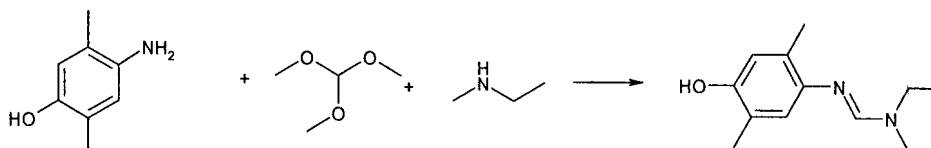
Se añadió una disolución de 0,2 g (1,5 mmol) de tricloruro fosfórico en 5 ml de tolueno a una mezcla de 0,3 g (3,0 mmol) de piperidin-2-ona, la reacción exotérmica se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Luego se añadió una disolución de 0,43 g (1,5 mmol) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina en 5 ml de tolueno y la mezcla de reacción se sometió a reflujo durante 5 h. A temperatura ambiente, se añadieron 5 ml de una disolución acuosa al 10% de hidróxido de sodio. La separación de las capas, extracción de la capa acuosa con 10 ml de tolueno, secado sobre sulfato de magnesio, concentración *in vacuo* y cromatografía en columna (gradiente: ciclohexano -> acetato de etilo) proporcionó 0,55 g (1,5 mmol) 99% de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetil-N-[piperidin-2-lideno]anilina; log P (pH 2,3) = 1,97

Ejemplo de preparación 5 - Procedimiento (c) - compuesto (I) a compuesto (I): N'-[4-[(5-(N-aliletanimidoil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida – compuesto 1.21



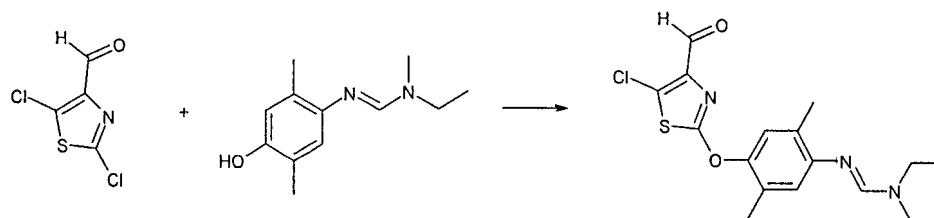
Se agitó una disolución de 0,3 g (0,87 mmol) de hidrocloreto de N'-{4-[(5-acetil-4-metil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida y 0,095 g (0,87 mmol) de 3-(aminooxi)prop-1-eno en una mezcla disolvente de 10 ml de metanol y 3 ml de agua a temperatura ambiente durante 5 días. Luego la mezcla se diluyó con agua y se añadió diclorometano. La separación de las capas, extracción de la fase acuosa con diclorometano, secado de la capa orgánica sobre sulfato de sodio y la evaporación del disolvente produjo 0,14 g (0,29 mmol) 33% de N'-{4-[(5-(N-aliletanimidoil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida como una mezcla de dos estereoisómeros; log P (pH 2,3) = 2,15 y 2,33.

Ejemplo de preparación 5 - Procedimiento (b3) - compuesto (III) a compuesto (IX): N-etil-N'-(4-hidroxi-2,5-dimetilfenil)-N-metilimidoformamida – intermedio (IX-a)



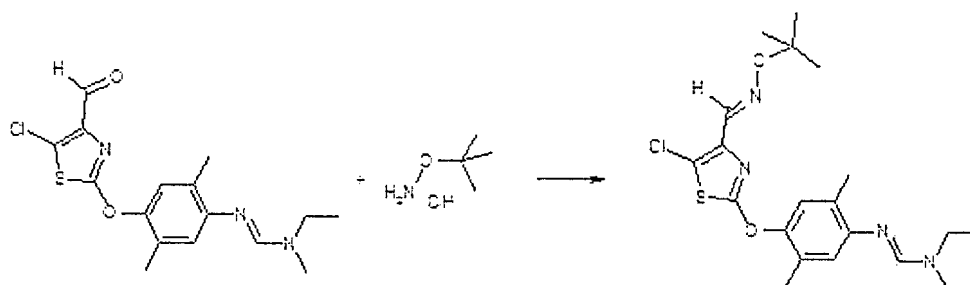
A una mezcla de 10,0 g (73 mmol) de 4-amino-2,5-dimetilfenol y 73 ml (0,84 mol) de trimetoximetano se le añadieron 0,73 g (4,2 mmol) de ácido p-tolueno sulfónico y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Luego los volátiles se eliminaron *in vacuo* y el residuo se disolvió en 73 ml de tolueno y se añadieron 12,9 g (217 mmol) de N-metiletanamina. La mezcla de reacción se calentó a 50°C durante 20 h y se concentró *in vacuo*. La cromatografía en columna (gradiente: ciclohexano -> acetato de etilo) produjo 9,17 g (44 mmol) 55% de N-etil-N'-(4-hidroxi-2,5-dimetilfenil)-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 0,41.

Ejemplo de preparación 6 - Procedimiento (a) – compuesto (IV) y compuesto (IX) a compuesto (I): N'-{4-[(5-cloro-4-formil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida – compuesto 1.42



A una disolución de 3,57 g (17 mmol) de N-etil-N'-(4-hidroxi-2,5-dimetilfenil)-N-metilimidoformamida en 60 ml de DMF se le añadieron 2,51 g (18 mmol) de carbonato de potasio y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 min. Luego se añadieron 3,00 g (16,5 mmol) de 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carbaldehído y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 7 días. Luego la mezcla de reacción se vertió en agua, diclorometano y se añadió algo de NaCl, las capas se separaron, la capa de agua se extrajo con diclorometano, la fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó. La cromatografía en columna (gradiente: diclorometano -> metanol) produjo 4,40 g (12,5 mmol) 67% de N'-[4-[(5-cloro-4-formil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida log P (pH 2,3) = 1,51

Ejemplo de preparación 7 - Procedimiento (c): N'-[4-[(4-[(terc-butoxiimino)metil]-5-cloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida – compuesto 1.44



Se agitó una disolución de 0,23 g (0,50 mmol) de hidrocloruro de N'-[4-[(5-cloro-4-formil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida y 63 mg (0,50 mmol) de 2-(aminooxi)-2-metilpropano en una mezcla de disolvente de 10 ml de metanol y 3 ml de agua a temperatura ambiente durante 5 días. La evaporación de los disolventes y la cromatografía en columna de la mezcla bruta (ciclohexano en gradiente -> acetato de etilo) produjo 130 mg (0,37 mmol) 61% de N'-[4-[(4-[(terc-butoxiimino)metil]-5-cloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida. Log P (pH 2,3) = 2,65

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-dimetilacetamid

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.

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 incluso mayor a una concentración de 1000 ppm de ingrediente activo: 1.1, 1.2, 1.3, 1.4, 1.5, 1.6, 1.7, 1.8, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.13, 1.15, 1.17, 1.18, 1.20, 1.23, 1.28, 1.29, 1.63, 1.71, 1.72, 1.73, 1.74, 1.75, 2.2, 2.3, 2.4, 2.7, 3.1, 3.2.

Ejemplo de eficacia B: Ensayo preventivo in vivo en *Erysiphe graminis* (oídio 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.

Después de que se ha secado el recubrimiento por 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.

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 incluso mayor a una concentración de 1000 ppm de ingrediente activo: 1.1, 1.2, 1.3, 1.4, 1.5, 1.6, 1.7, 1.8, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.13, 1.17, 1.18, 1.20, 1.23, 1.28, 1.29, 2.2, 2.3, 2.4, 3.1, 3.2.

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 alquilaril poliglicoléter

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 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%.

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: 1.1, 1.2, 1.3, 1.4, 1.5, 1.7, 1.7, 1.8, 1.9, 1.12, 1.13, 1.14, 1.16, 1.17, 1.19, 1.20, 1.21, 1.24, 1.27, 1.63, 1.64, 1.65, 1.66, 1.70, 1.71, 1.74, 2.3, 2.7, 3.2, 3.20, 3.21, 3.24, 3.31, 3.34, 3.35, 3.39.

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 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 ha secado el recubrimiento por pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del agente causal de mildiú de 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: 1.1, 1.2, 1.3, 1.4, 1.5, 1.6, 1.7, 1.8, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.15, 1.17, 1.18, 1.71, 1.72, 1.74, 1.75, 2.3, 2.7.

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

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.

5 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%.

10 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: 1.1, 1.2, 1.3, 1.4, 1.5, 1.6, 1.7, 1.8, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.15, 1.18, 1.21, 1.63, 2.3.

Ejemplo de eficacia F: 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

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.

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 del agente causal de roya de judías (*Uromyces appendiculatus*) y luego se deja durante 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y a 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%.

30 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: 1.2, 1.71, 1.72, 1.74, 1.75, 2.7.

Ejemplo de eficacia G :Myzus persicae – ensayo: (aplicación de pulverización MYZUPE)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Agente humectante: 0,5 partes 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.

Discos foliares de repollo chino (*Brassica pekinensis*) infectados con todas las fases del pulgón del melocotón verde (*Myzus persicae*), se pulverizan con una preparación del ingrediente activo a la concentración deseada.

Después del período de tiempo especificado, se determina la mortalidad en %. 100% significa que todos los pulgones han sido exterminados; 0% significa que ninguno de los pulgones ha sido exterminado.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación demostraron buena actividad: 1,25

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

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

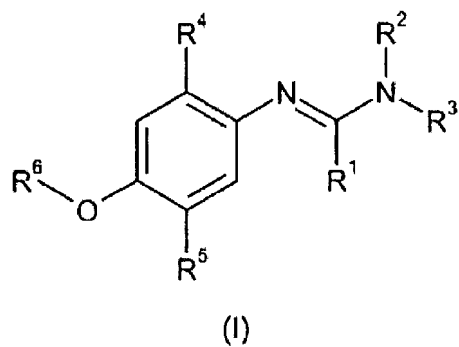
Se rocían cortes de hoja de soja (*Glycine max.*) con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secos, los cortes de hoja se infestan con huevos de gusano del algodón (*Heliotis virescens*).

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.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación demostraron buena actividad: 1,11, 1,23, 1,25, 1,26.

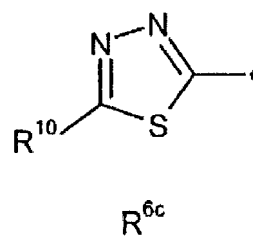
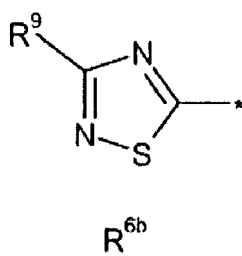
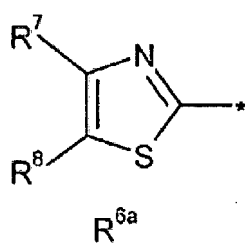
REIVINDICACIONES

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



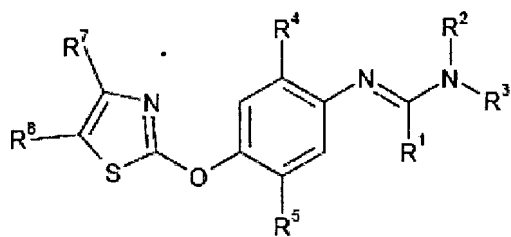
En la que

R^6 representa un heterociclo seleccionado de la lista que consiste en



y

- a) el compuesto

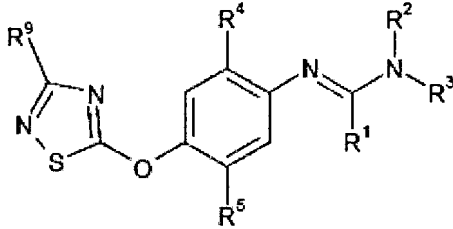


que tiene las siguientes definiciones:

No.	R2	R3	R1	R4	R5	R7	R8
1.1	Me	Et	H	Me	Me	Cl	Cl
1.2	Me	Et	H	Me	Me	-CH=CH-C(Cl)=CH-	
1.3	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	Cl
1.4	Me	Et	H	Me	Me	tBu	Cl
1.5	Me	Et	H	Me	Me	CF3	Cl
1.6	Me	Et	H	Me	Me	Cl	Br
1.7	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	Cl
1.8	Me	Et	H	Me	Me	-CH=CH-CH=CH-	
1.9	Me	iPr	H	Me	Me	iPr	Cl
1.10	Me	iPr	H	Me	Me	CF3	Cl
1.11	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	Br
1.12	Me	Et	H	Me	Me	Me	Cl
1.13	Me	iPr	H	Me	Me	Me	Cl
1.14	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	H
1.15	Me	n-Pr	H	Me	Me	-CH=CH-C(Cl)=CH-	
1.16	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NO-t-Bu
1.17	Me	Et	H	Me	Me	Cl	Me
1.18	Me	Et	H	Me	Me	Cl	H
1.19	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NOMe
1.20	Me	Et	H	Me	Me	iPr	Cl
1.21	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NO-CH2CH=CH2
1.23	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	Me
1.24	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NOCH(Me)Ph
1.25	H	-CH2CH2CH2CH2-		Me	Me	Cl	Cl
1.26	-CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	Cl
1.27	Me	Et	H	Me	Me	Me	Ac
1.28	Me	iPr	H	Me	H	Cl	Cl
1.29	Me	n-Pr	H	Me	Me	-CH=CH-CH=CH-	
1.30	-CH2CH2-O-CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	Cl
1.31	Me	Me	H	Me	Me	Cl	Me
1.32	H	-CH2CH2CH2-		Me	Me	Cl	Cl
1.33	Me	Et	H	Me	H	Me	Me
1.34	Me	iPr	H	Me	H	Me	Me
1.35	Me	iPr	H	Me	Me	Me	nPr
1.36	Me	Et	H	Me	Me	Me	nPr
1.37	Me	iPr	H	Me	Me	Me	Me
1.38	Me	Et	H	Me	Me	Me	Me
1.39	Me	Et	H	Me	H	Cl	Cl
1.40	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMe=NOH
1.41	Me	iPr	H	Me	Me	Me	CMe=NOH
1.42	Me	Et	H	Me	Me	CHO	Cl
1.43	Me	Et	H	Me	Me	CH=NOMe	Cl
1.44	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-t-Bu	Cl
1.45	Me	Et	H	Me	Me	CH-NO-CH2CH=CH2	Cl
1.46	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-Et	Cl
1.47	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-Ph	Cl
1.48	Me	Et	H	Me	Me	CMe=NOCH(Me)Ph	Cl

1.49	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(4-t-Bu)-Ph	Cl
1.50	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(4-NO2)Ph	Cl
1.51	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(3-Me)-Ph	Cl
1.52	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(3-Cl)-Ph	Cl
1.53	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(4-CF3)-Ph	Cl
1.54	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-CH2-(3-CF3)-Ph	Cl
1.55	Me	Et	H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph
1.56	Me	iPr	H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph
1.57	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CH=NOMe
1.58	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CH=NO-CH2CH=CH2
1.59	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CH=NO-CH2-Ph
1.60	Me	Et	H	Me	Me	Ph	H
1.61	Me	iPr	H	Me	Me	Ph	H
1.62	Me	Et	H	Me	Me	Cl	CHO
1.63	Me	Et	H	Me	Me	CH=NOH	Cl
1.64	Me	iPr	H	Me	Me	tBu	Cl
1.65	-CH2CH2CH2CH2CH2- -CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	tBu	Cl
1.66			H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph
1.70	Me	iPr	H	Me	Me	-CCl=CH-CH=CH-	
1.71	Me	Et	H	Me	Me	tBu	Br
1.72	Me	Et	H	Me	Me	CN	Cl
1.73	Me	Et	H	Me	Me	Cl	tBu
1.74	Me	Et	H	Me	Me	H	tBu
1.75	Me	Et	H	Me	Me	tBu	H

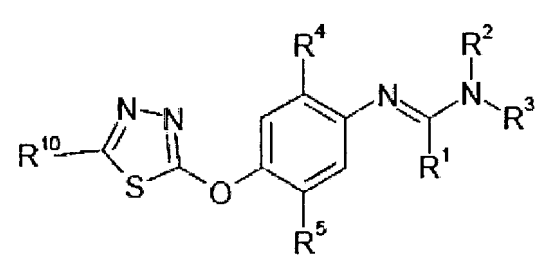
b) el compuesto



que tiene las siguientes definiciones:

No	R1	R2	R3	R4	R5	R9
2.2	H	Me	Et	Me	H	i-Pr
2.3	H	Me	Et	Me	Me	i-Pr
2.4	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr
2.7	H	Me	Et	Me	H	t-Bu

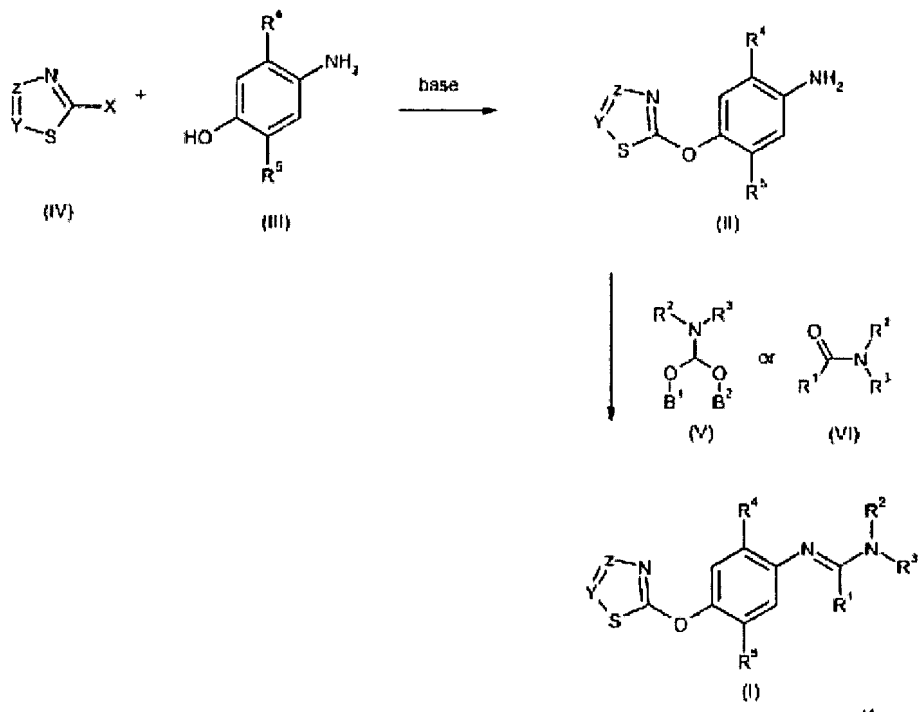
c) el compuesto



Que tiene las siguientes definiciones:

No	R1	R2	R3	R4	R5	R10
3.1	H	Me	i-Pr	Me	Me	CF3
3.2	H	Me	Et	Me	Me	CF3
3.20	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl-Ph
3.21	H	Me	Et	Me	Me	Sme
3.24	H	Me	Et	Me	Me	3-Cl-4-F-Ph
3.31	H	Me	Et	Me	Me	3-Me-Ph
3.34	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-Cl-4-F-Ph
3.35	H	-CH2CH2CH2CH2-		Me	Me	4-OCF3-Ph
3.39	H	-CH2CH2CH2CH2-		Me	Me	2-Cl-Ph

2) Un procedimiento para la preparación de un compuesto de formula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende las siguientes etapas:



donde el proceso puede además comprender diluyentes, bases, ácidos o agentes de condensación;

los diluyentes adecuados para llevar a cabo el procedimiento son hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalin; hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butílico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-di-etoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o isobutironitrilo 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; o

ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; 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, metoxi-etanol, dietilenglicol-monometiléter, dietilenglicolmonoetiléter; sus mezclas con agua o agua pura;

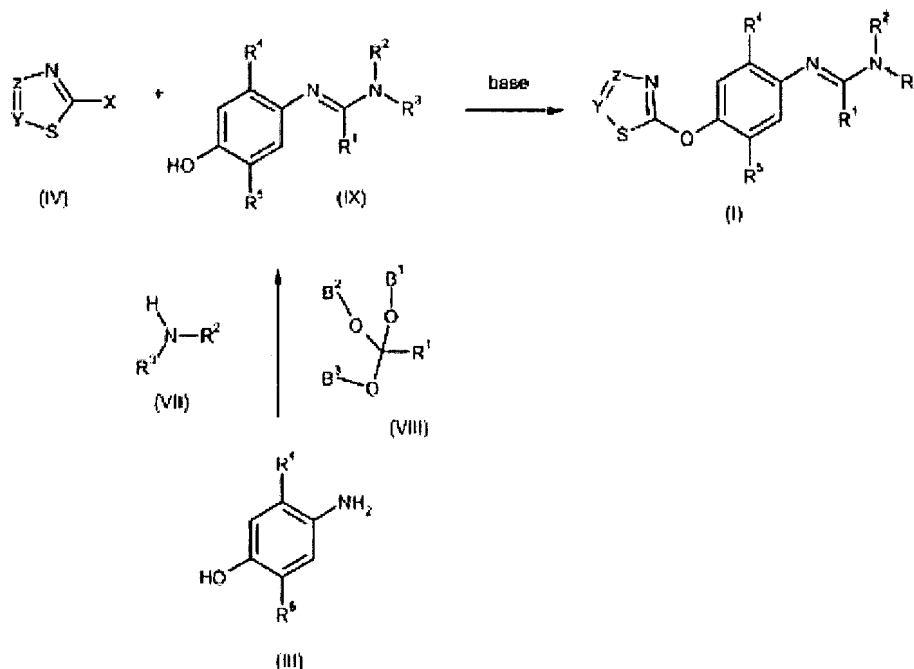
las bases adecuadas para llevar a cabo el procedimiento son bases de metal alcalino térreo o hidruros de metal alcalino, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrógeno carbonatos, como hidruro de sodio, amida de sodio, diisoproilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, 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) o

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 son el 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 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 bromotripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato;

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.

3) Un procedimiento para la preparación de un compuesto de formula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende las siguientes etapas:



donde el proceso puede además comprender diluyentes, bases, ácidos o agentes de condensación;

los diluyentes adecuados para llevar a cabo el procedimiento son hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalin; hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butílico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-di-etoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o isobutironitrilo 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; o

ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; 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, metoxi-etanol, dietilenglicol-monometiléter, dietilenglicolmonoetiléter; sus mezclas con agua o agua pura;

las bases adecuadas para llevar a cabo el procedimiento son bases de metal alcalino térreo o hidruros de metal alcalino, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrógeno carbonatos, como hidruro de sodio, amida de sodio, diisoproilamida 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) o

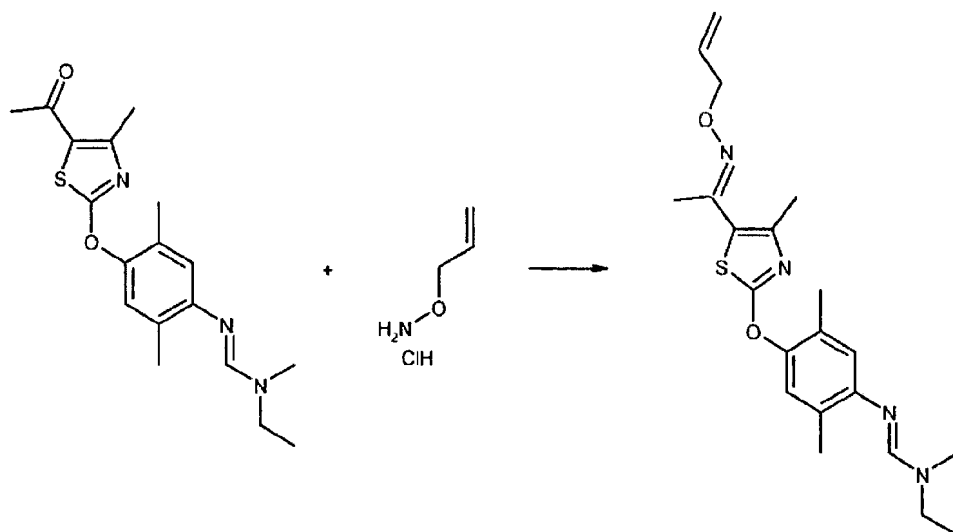
ácido para-tolueno sulfónico, ácido metanosulfónico, ácido clorhídrico (disolución gaseosa, acuosa u orgánica) o ácido sulfúrico;

los agentes de condensación adecuados para llevar a cabo el procedimiento son el 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 N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensadores habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, o bromotripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato;

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.

4) Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende las siguientes etapas:

Se hace reaccionar el hidrocloreto de N'-{4-[(5-acetil-4-metil-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida y 3-(aminooxi)prop-1-eno:



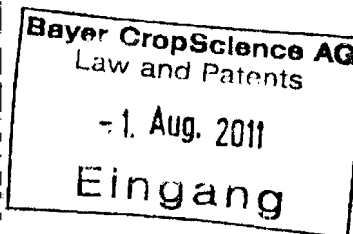
Los diluyentes adecuados para llevar a cabo el procedimiento son hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metil-ciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalin; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil terc-butílico, éter metil terc-amílico, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-di-etoxietano 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 dimetilsulfóxido; 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, metoxi-etanol, dietilenglicol-monometiléter, dietilenglicolmonoetiléter; sus mezclas con agua o agua pura;

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.

KONTROLL:

SARGENT & KRAHN®

PROPIEDAD INTELECTUAL E INDUSTRIAL
Fundada en 1889



AV. ANDRES BELLO 2711
PISO 19 LAS CONDES
SANTIAGO, CHILE
TEL (56-2) 368 3500
FAX (56-2) 360 4010

WWW.SARGENT.CL

June 23, 2011

BSC-Patents-Licensing@bayercropscience.com

Privileged & Confidential

Messrs.

BAYER CROPSCIENCE AG

Business Planning and Administration

Law and Patents

Patents and Licensing

Alfred-Nobel-Strasse 50, Building 6100

40789 Monheim

GERMANY

Y/Ref.: BCS05-4027-CL

O/Ref.: 807.053

Attn.: Dr. Gerhards

Dear Dr. Gerhards,

Chilean Patent Application No. 2385-2006 in the name of Bayer Cropscience AG

We have pleasure to inform that the patent application of the reference has been accepted to grant on May 27, 2011 and will be in force until September 8, 2026, as per enclosed acceptance notice.

We are now proceeding with the payment of the official grant fees.

As soon as the registration number is available, we will immediately inform you of the same.

Yours sincerely,

SARGENT & KRAHN

Juan Francisco Reyes

{S-0242632/VVV/v.1}