

Q.P.



Organización CSA Ltda

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA



Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

08-34065

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO "DERIVADOS PLAGUICIDAS DE FENILAMIDA
SUSTITUIDA CON TIAZOLILOXI"

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE BAYER CROSCIENCE AG

DOMICILIO ALEMANIA

74. APODERADO ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
T.P. 20.281

22. BOGOTÁ, D. C., ABRIL, 2008

720081000009



13 April 2008

SOLICITUD DE :	
☒ Patente de Invención	☐ Patente de Modelo de Utilidad
☒ Capítulo I.	☐ Capítulo II.
(2) SOLICITANTE (71)	Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim Am Rhein, Alemania Nacionalidad o Domicilio: Alemania Lugar de Constitución: Alemania Teléfono: Fax: E-Mail:
	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número Cual
(3) REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ Dirección: Avenida 82 No.16-62 Piso 6 Teléfono: 634 1500 Fax: 376 2211 E-Mail: office.bogota@bakernet.com
	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número 79.143.366 de Usaquén TP 20.281
(4) INVENTOR (ES) (72)	Nombre: KUNZ, Klaus; GREUL, Jörg; GÜTH, Oliver; HARTMANN, Benoit; ILG, Kerstin; MORADI, Wabed; SEITZ, Thomas; DAHMEN, Peter; VOERSTE, And; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike; DUNKEL, Ralf; EIBERT, Ronald; FRANKEN, Eva-Maria y MALSAM, Olga Dirección: Hochdahlner Strasse 3, 40625 Düsseldorf, Alemania; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen, Alemania; Lohrstrasse 72e, 51371 Leverkusen, Alemania; 12 chemin Antoinette, F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon, Francia; Isidor-Caro-Strasse 52, 51061 Köln, Alemania; Maria-Merian Strasse 7, 40789 Monheim an Rhein, Alemania; Rietherbach 10b, 40764 Langenfeld, Alemania; Alleebrückerstrasse 63, 41470 Neuss, Alemania; Mozartstrasse 3-5, 50674 Köln, Alemania; Öberer Markenweg 85, 56566 Neuried, Alemania; 11 Rue Pierre Dupont, F-69001 Lyon, Francia; Leskowsstrasse 60, 90475 Nürnberg, Alemania; Sternstrasse 21, 42799 Leichlingen, Alemania y Vor Dem Klosterhof 19, 51503 Rösrath, Alemania Nacionalidad o Domicilio: Alemán, Alemán, Alemán, Francés, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, Alemán, respectivamente
(5) PCT (85)	
Solicitud Internacional No.	PCT/EP2006/066273
Publicación Internacional No.	WO/2007/031513
Fecha 12-SEP-05	
Fecha 22-MAR-07	
(6) Título (54) DERIVADOS PLAGUICIDAS DE FENILAMIDA SUSTITUIDA CON TIAZOLILOXI	
(7) Clasificación Internacional (51) C07D 277/34, A01N 43/78, A01N 43/82, A01N 43/84, A01P 3/00, A01P 7/04, C07D 277/56, C07D 277/68, C07D 285/08, C07D 285/125, C07D 417/12	
(8) Prioridad	(33) País de Origen
SI ☒ NO ☐	EP
	(32) Fecha 13-SEP-05
	(31) Número de Solicitud 05356155.1
(9) Comprobante de pago No. 08-23073	
Fecha 17-MAR-08	

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

2008 / 006

NIT : 800173089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 23,073
FECHA : MARZO 17 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-034065-00000-0000

Fecha: 2008-04-04 16:29:51 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Evs: 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACION Folios: 110

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
BAKER & WICKENHE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	042754387	116634	14/03/2008	52,393,366.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



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

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/031513 A1

(51) International Patent Classification:

C07D 277/34 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
C07D 277/56 (2006.01) A01N 43/82 (2006.01)
C07D 277/68 (2006.01) A01N 43/84 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01) A01P 3/00 (2006.01)
C07D 285/125 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
C07D 285/08 (2006.01)

F-69001 Lyon (FR). EBBERT, Ronald [DE/DE]; Nikolaus-Kopernikus-Strasse 13, 40789 Monheim (DE). FRANKEN, Eva-Maria [DE/DE]; Sternstrasse 21, 42799 Leichlingen (DE). MAISAM, Olga [DE/DE]; Vor Dem Klosterhof 19, 51503 Rösrath (DE).

(21) International Application Number:

PCT/EP2006/066273

(22) International Filing Date:

12 September 2006 (12.09.2006)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

05356155.1 13 September 2005 (13.09.2005) EP

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

(72) Inventors; and

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

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

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

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

Declarations under Rule 4.17:

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

Published:

- with international search report

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

(54) Title: PESTICIDE THIAZOLYLOXY SUBSTITUTED PHENYLAMIDINE DERIVATIVES

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

WO 2007/031513 A1

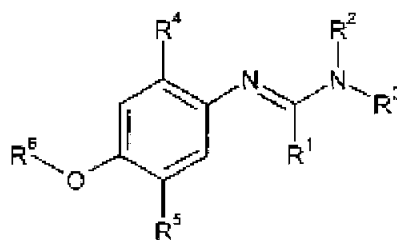
PESTICIDE THIAZOLYLOXY SUBSTITUTED PHENYLAMIDINE DERIVATIVES

DESCRIPTION

- 5 The present invention relates to aryloxy substituted phenylamidine derivatives, their process of preparation, their use as fungicide or insecticide active agents, particularly in the form of fungicide or insecticide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi or damaging insects, notably of plants, using these compounds or compositions.
- 10 In international patent application WO-00/46184 certain phenyl-amidine derivatives are disclosed. However, this document does not specifically disclose nor suggest to select such compounds wherein the phenyl ring is substituted according to the invention thus allowing an unexpected and significantly higher fungicide activity.
- 15 It is always of high-interest in agriculture to use novel pesticide compounds in order to avoid or to control the development of resistant strains to the active ingredients. It is also of high-interest to use novel compounds being more active than those already known, with the aim of decreasing the amounts of active compound to be used, whilst at the same time maintaining an effectiveness at least equivalent to the already known compounds.
- 20 In the same way, it is also always of high-interest to use novel insecticide, nematocide or acaricide agents to control damaging insects or other damaging organisms.

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

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



(I)

wherein

- R¹ represents H, a substituted or non substituted C₁-C₁₂-alkyl, a substituted or non substituted C₂-C₁₂-alkenyl, a substituted or non substituted C₂-C₁₂-alkynyl, SH or a substituted or non substituted S-C₁-C₁₂-alkyl ;
- R² represents a substituted or non substituted C₁-C₁₂-alkyl ;

- R¹³ represents H, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl ;
- R¹⁴ represents H, substituted or non substituted, branched or linear C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy ;
- R¹⁵ represents H, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl ;
- 5 • R¹⁶ represents H, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₈-alkoxy, substituted or non substituted benzyl ;
- R¹² and R¹³ can form a 5- or 6-membered heterocycle, which can further comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S;
- 10 • R¹⁵ and R¹⁶ can form a heterocyclic 5- or 6-membered ring, including further heteroatoms, like O, S, N;

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

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

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

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

Preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R¹ represents
30 H ; C₁-C₁₂-alkyl, preferably C₁-C₁₂-alkyl like methyl ; or SH.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R² represents methyl.

35 Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R³ represents C₂-C₁₂-alkyl, preferably a non substituted C₂-C₄-alkyl like ethyl, n-propyl, i-propyl ; C₂-C₁₂-alkenyl, preferably C₃-C₄-alkenyl like propenyl or allyl ; C₃-C₈-cycloalkyl like cyclopropyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{10} represents H, Cl, Br, I, cyano; phenyl; phenyl substituted by F, Cl, Br, I, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_2 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy; benzyl; benzyl substituted by F, Cl, Br, I, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy; pyridyl; pyridyl substituted by F, Cl, Br, I, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy; C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -halogenalkyl, C_1 - C_4 -halogenalkoxy or C_1 - C_4 -halogenalkylthio; C_1 - C_4 -alkyl- $S(O)_mR^{11}$; C_1 - C_4 -alkyl- $SO_2NR^{12}R^{13}$; C_1 - C_4 -alkyl-COR¹⁴; $-CR^{15}=N-O-R^{16}$, $S(O)_mR^{11}$, $SO_2NR^{12}R^{13}$, COR¹⁴.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{11} represents C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{12} represents H, C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{13} represents H, C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{14} represents H, branched or linear C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -alkoxy.

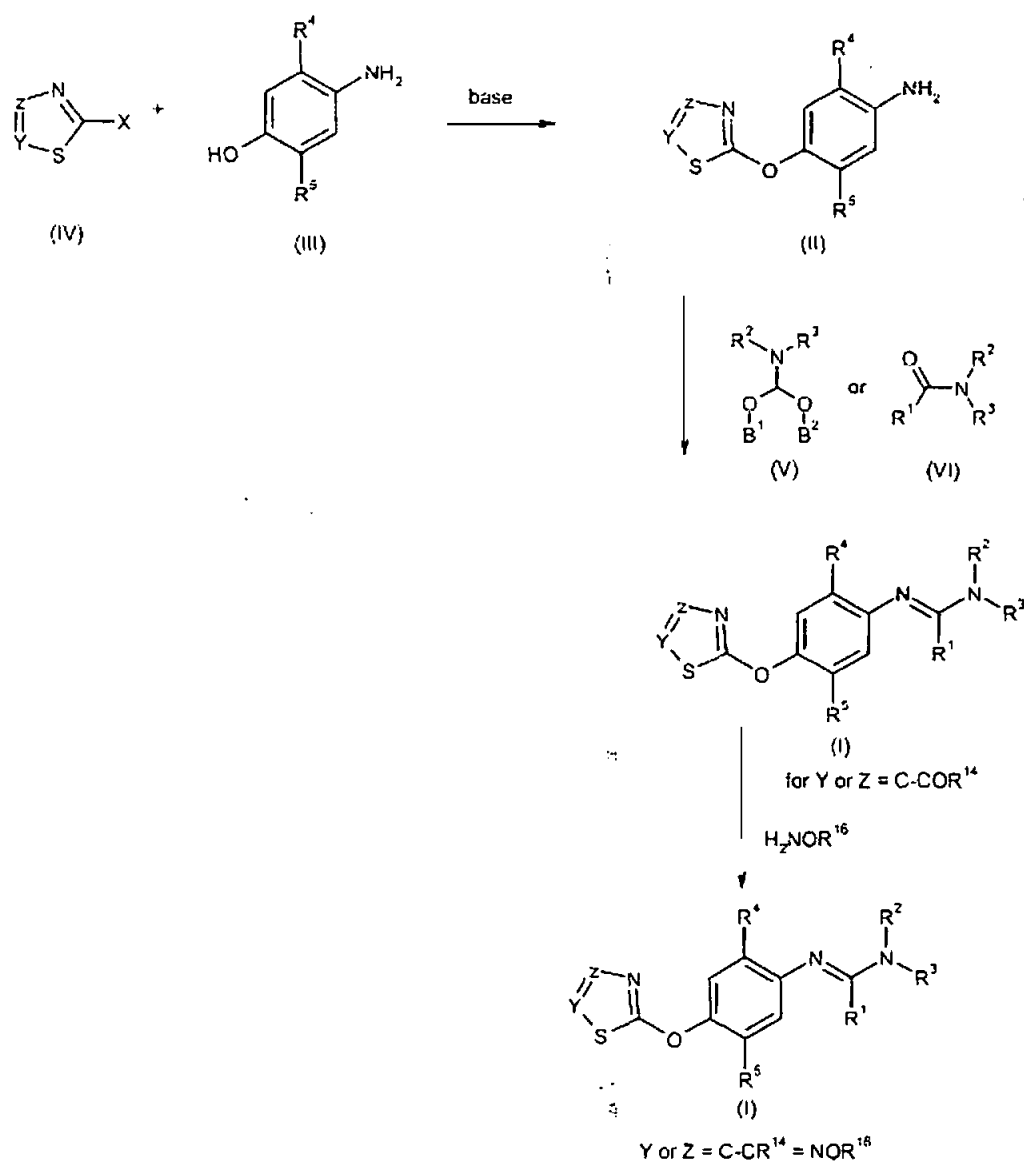
Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{15} represents H, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{16} represents H, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, benzyl; benzyl substituted by halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl.

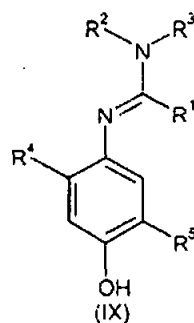
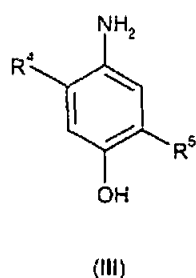
Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{12} and R^{13} form a 5- or 6-membered heterocycle, which can further comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S.

Still other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^{15} and R^{16} can form a 5- or 6-membered heterocycle comprising further heteroatoms, like O, S, N.

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

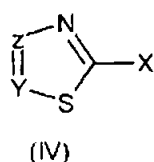


Scheme 1

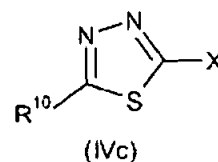
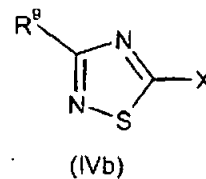
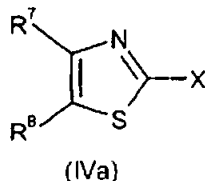


wherein

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as herein-defined,
- with thiazole derivatives or thiadiazole derivatives (1,3,4-thiadiazoles or 1,3,5-thiadiazoles) of
- 5 formula (IV) or (IVa), (IVb) and (IVc), respectively,

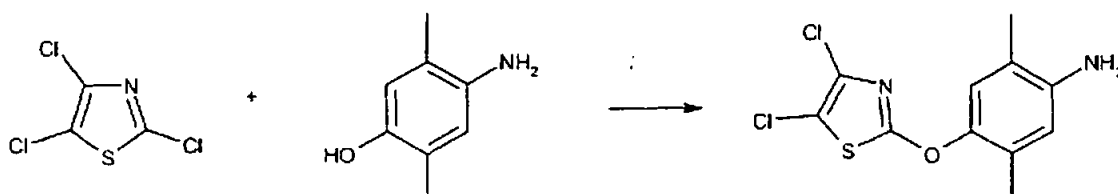


represents



wherein

- Z, Y, R^7 , R^8 , R^9 and R^{10} are as herein-defined
 - X represents halogen, triflate, SOME, mesylate or tosylate.
- 10 Process (a) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:
- presence of a base;
 - presence of an inert organic diluent;
 - presence of a catalyst.
- 15 Process (a) according to the invention is carried out using 4-amino-2,5-dimethylphenol, 2,4,5-trichloro-1,3-thiazole and a base as starting materials. Process (a) can be conducted according to scheme 2.



Scheme 2

20

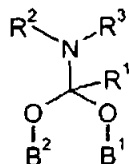
Formula (IV) or formulae (IVa), (IVb) and (IVc), respectively, provide general definitions for the thiazole derivatives and thiadiazole derivatives useful as starting materials for carrying out process (a) according to the invention.

Formulae (III) and (IX) provide a general definition of the aminophenol derivatives or amidine

25 derivatives useful as starting materials for carrying out process (a) according to the invention. In

Formula (II) provides a general definition of the biphenylamine derivatives useful as starting materials for carrying out process (b1) according to the invention. In this formula R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , Y and Z preferably represent substituents as herein-defined in connection with the description of compounds of formula (I) according to the invention.

Process (b2) is carried out further using amino-acetal derivatives of formula (V)



(V)

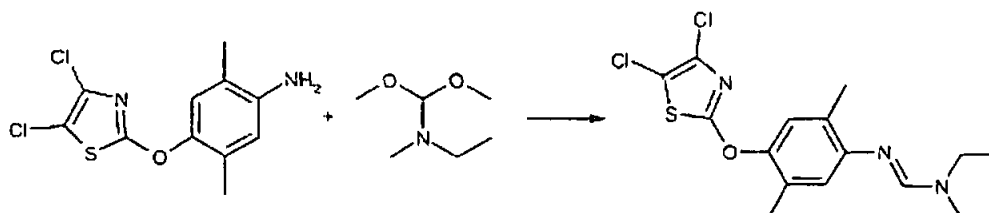
wherein

- R^1 , R^2 , R^3 are as herein-defined ;
- B^1 and B^2 represent each alkyl or together cycloalkyl.

Process (b2) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:

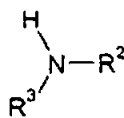
- presence of an acid or base;
- presence of a diluent.

Process (b2) according to the invention is carried out using 4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylaniline and N-(dimethoxymethyl)-N-methylethanamine as starting materials. Process (b2) can be conducted according to scheme 4.



Scheme 4

Process (b3) is carried out further using amine derivatives of formula (VII)

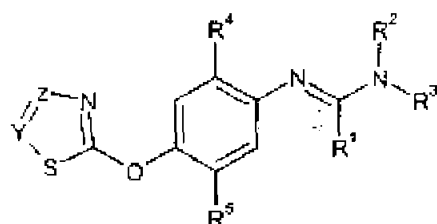


(VII)

wherein

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

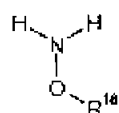
in presence of orthoester derivatives of formula (VIII)



(I)

wherein

- 5 • Y or Z represent C-COR₁₄ and R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as herein-defined with hydroxylamines or salts thereof, respectively

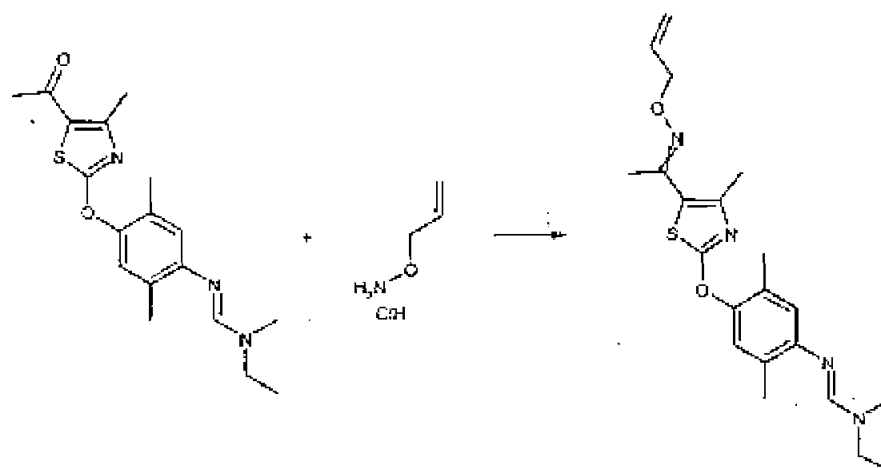


(X)

wherein R¹⁶ is as herein-defined.

- 10 Process (c) according to the invention can further comprise one or more of the following characteristics:
- presence of an acid or a base;
 - presence of an inert organic diluent;
 - presence of a catalyst.
- 15 Process (c) according to the invention is carried out using N'-[4-[(5-acetyl-4-methyl-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl]-N-ethyl-N-methylimidoformamide and 3-(aminooxy)prop-1-ene hydrochloride as starting materials.

Process (c) can be conducted according to scheme 6.



Scheme 6

acid, methane sulfonic acid, hydrochloric acid (gas, aqueous or organic solution) or sulphuric acid.

Suitable condensing agents for carrying out process (b1) according to the invention are all
5 condensing agents customary for such amidation reactions. Preference is given to using acid
halide former, such as phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride,
phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; anhydride former,
such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl
10 chloroformate or methanesulfonyl chloride; carbodiimides, such as N,N'-dicyclo-
hexylcarbodiimide (DCC) or other customary condensing agents, such as phosphorous
pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-
dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-tripyrrolidino-
phosphonium-hexafluorophosphate.

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

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

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

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

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

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

According to the invention, the term "support" denotes a natural or synthetic, organic or
inorganic compound with which the active compound of formula (I) is combined or associated to

These compositions include not only compositions which are ready to be applied to the plant or seed to be treated by means of a suitable device, such as a spraying or dusting device, but also concentrated commercial compositions which must be diluted before application to the crop.

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

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

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

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

B3) a compound capable to inhibit the respiration for example

as CI-respiration inhibitor like diflumetorim ;

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

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

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

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

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

- 30 B7) a compound capable to inhibit the signal transduction like fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen ;

salts, piperalin, propanosine-sodium, proquinazid, pyrrolnitrine, quintozone, tecloftalam, tecnazene, triazoxide, trichlarnide, zarilamid and 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)-pyridine, N-(4-Chloro-2-nitrophenyl)-N-ethyl-4-methyl-benzenesulfonamide, 2-amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolecarboxamide, 2-chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridinicarboxamide, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, cis-1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)-cycloheptanol, methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate, 3,4,5-trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile, Methyl 2-[[[cyclopropyl(4-methoxyphenyl)imino]methyl]thio]methyl]-alpha-(methoxymethylene)-benzeneacetate, 4-Chloro-alpha-propynyloxy-N-[2-[3-methoxy-4-(2-propynyloxy)phenyl]ethyl]-benzeneacetamide, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-N-[(1R)-1,2,2-trimethylpropyl][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, 5-chloro-N-[(1R)-1,2-dimethylpropyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloronicotinamide, N-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl-2,4-dichloronicotinamide, 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyranon-4-one, N-[(Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl]-2-phenylacetamide, N-(3-ethyl-3,5,5-trimethyl-cyclohexyl)-3-formylamino-2-hydroxy-benzamide, 2-[[[1-[3(1Fluoro-2-phenylethyl)oxy]phenyl]ethylidene]amino]oxy]methyl]-alpha-(methoxyimino)-N-methyl-alpha-E-benzeneacetamide, N-[2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide, N-(3',4'-dichloro-5-fluorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, 2-(2-[[6-(3-chloro-2-methylphenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yl]oxy]phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylacetamide, 1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl-1H-imidazole-1-carboxylic acid, O-[1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl]-1H-imidazole-1-carbothioic acid.

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

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

Phakopsora diseases, caused for example by *Phakopsora pachyrhizi* or *Phakopsora meibomiae* ;

Puccinia diseases, caused for example by *Puccinia recondita* ;

Uromyces diseases, caused for example by *Uromyces appendiculatus* ;

5 Oomycete diseases such as :

Bremia diseases, caused for example by *Bremia lactucae* ;

Peronospora diseases, caused for example by *Peronospora pisi* or *P. brassicae* ;

Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora infestans* ;

Plasmopara diseases, caused for example by *Plasmopara viticola* ;

10 Pseudoperonospora diseases, caused for example by *Pseudoperonospora humuli* or *Pseudoperonospora cubensis* ;

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

Leafspot, leaf blotch and leaf blight diseases such as :

Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria solani* ;

15 Cercospora diseases, caused for example by *Cercospora belicola* ;

Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium cucumerinum* ;

Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus* ;

Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum* ;

Cyloconium diseases, caused for example by *Cyloconium oleaginum* ;

20 Diaporthe diseases, caused for example by *Diaporthe citri* ;

Elsinoe diseases, caused for example by *Elsinoe fawcettii* ;

Gloeosporium diseases, caused for example by *Gloeosporium laeticolor* ;

Glomerella diseases, caused for example by *Glomerella cingulata* ;

Guignardia diseases, caused for example by *Guignardia bidwelli* ;

25 Leptosphaeria diseases, caused for example by *Leptosphaeria maculans* ; *Leptosphaeria nodorum* ;

Magnaporthe diseases, caused for example by *Magnaporthe grisea* ;

Mycosphaerella diseases, caused for example by *Mycosphaerella graminicola* ;

Mycosphaerella arachidicola ; *Mycosphaerella fijiensis* ;

30 Phaeosphaeria diseases, caused for example by *Phaeosphaeria nodorum* ;

Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora teres* ;

Ramularia diseases, caused for example by *Ramularia collo-cygni* ;

Rhynchosporium diseases, caused for example by *Rhynchosporium secalis* ;

Septoria diseases, caused for example by *Septoria apii* or *Septoria lycopersici* ;

35 Typhula diseases, caused for example by *Typhula incarnata* ;

Venturia diseases, caused for example by *Venturia inaequalis* ;

Root and stem diseases such as :

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

Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium oxysporum* ;

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

Diseases of flowers and Seeds such as :

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

Diseases of tubers such as :

5 Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*.

Among the damaging pests or insects that can be controlled at any development stage according to the insecticide method of the invention, mention may be made to :

- 10 • the order of the *Anoplura* (*Phthiraptera*), for example, *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.;
- the class of the *Arachnida*, for example, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epirimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp.,
15 *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*;
- 20 • the class of the *Bivalva*, for example, *Dreissena* spp.;
- the order of the *Chilopoda*, for example, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;
- the order of the *Coleoptera*, for example, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp.,
25 *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorrhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp.,
30 *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Plinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Stemecus* spp.,
35 *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp..
- the order of the *Collembola*, for example, *Onychiurus armatus*;
- the order of the *Dermaptera*, for example, *Forficula auricularia*;

- Coccus* spp., *Cryptomyzus* *ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis* *bilobatus*, *Geococcus* *coffae*, *Homalodisca* *coagulata*, *Hyalopterus* *arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax* *striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis* *erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* *fimbriolata*, *Melanaphis* *sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium* *dirhodum*, *Monellia* *costalis*, *Monelliopsis* *pecanis*, *Myzus* spp., *Nasonovia* *ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* *lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia* *praelonga*, *Parabemisia* *myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus* *maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus* *passerinii*, *Phorodon* *humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis* *aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria* *pyriformis*, *Pseudaulacaspis* *pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., *Quesada* *gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scephoides* *titanus*, *Schizaphis* *graminum*, *Selenaspidus* *articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella* *furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala* *festina*, *Tenalaphara* *malayensis*, *Tinocallis* *caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* *vaporariorum*, *Triozia* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus* *vitifolii*;
- the order of the Hymenoptera, for example, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium* *pharaonis*, *Vespa* spp.;
 - the order of the Isopoda, for example, *Armadillidium* *vulgare*, *Oniscus* *asellus*, *Porcellio* *scaber*;
 - the order of the Isoptera, for example, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.;
 - the order of the Lepidoptera, for example, *Acronicta* *major*, *Aedia* *leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama* *argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra* *brassicae*, *Buccutatrix* *thurberiella*, *Bupalus* *pinarius*, *Cacoecia* *podana*, *Capua* *reticulana*, *Carpocapsa* *pomonella*, *Cheimatobia* *brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura* *fumiferana*, *Clysis* *ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias* *insulana*, *Ephestia* *kuehniella*, *Euproctis* *chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria* *mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila* *pseudospretella*, *Homona* *magnanima*, *Hyponomeuta* *padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis* *blancardella*, *Lithophane* *antennata*, *Loxagrotis* *albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma* *neustria*, *Mamestra* *brassicae*, *Mocis* *repanda*, *Mythimna* *separata*, *Oria* spp., *Oulema* *oryzae*, *Panolis* *flammea*, *Pectinophora* *gossypiella*, *Phyllocnistis* *citrella*, *Pieris* spp., *Plutella* *xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudatetia* spp., *Pseudoplusia* *includens*, *Pyrausta* *nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia* *gemmatalis*, *Tinea* *pellionella*, *Tineola* *bisselliella*, *Tortrix* *viridana*, *Trichoplusia* spp.;
 - the order of the Orthoptera, for example, *Acheta* *domesticus*, *Blatta* *orientalis*, *Blattella* *germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea* *maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta* *americana*, *Schistocerca* *gregaria*;
 - the order of the Siphonaptera, for example, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla* *cheopis*.

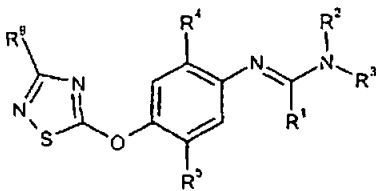
- the order of the *Saltatoria*, for example, *Acheta domesticus*;
- the order of the *Dermaptera*, for example, *Forficula auricularia*;
- the order of the *Isoptera*, for example, *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.;
- the order of the *Psocoptera*, for example, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.;
- 5 • the order of the *Coleoptera*, for example, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- the order of the *Diptera*, for example, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*,
10 *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;
- the order of the *Lepidoptera*, for example, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*;
- 15 • the order of the *Siphonaptera*, for example, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- the order of the *Hymenoptera*, for example, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*;
- 20 • the order of the *Anoplura*, for example, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*;
- the order of the *Heteroptera*, for example, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

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

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

35

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	-CCl=CH-CH=CH		2.17
1.68	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	-CCl=CH-CH=CH		2.34
1.69	Me	nPr	H	Me	Me	-CCl=CH-CH=CH		2.29
1.70	Me	iPr	H	Me	Me	-CCl=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



5 Table2:

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

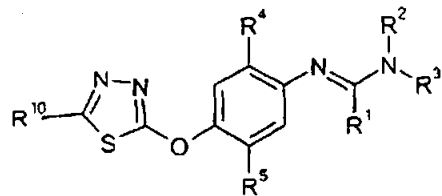
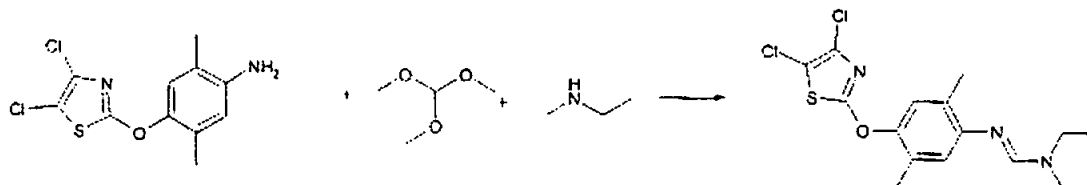


Table3:

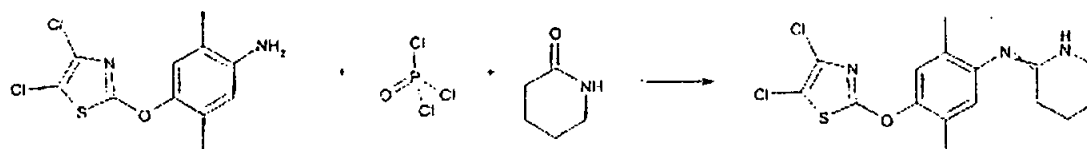
3.22	H	Me	Et	Me	Me	i-Pr	1.61
3.23	H	Me	Et	Me	Me	cyclo-Pr	1.50
3.24	H	Me	Et	Me	Me	3-Cl-4-F-Ph	2.13
3.25	H	Me	i-Pr	Me	Me	4-MeO-Ph	2.02
3.26	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-MeO-Ph	2.06
3.27	H	Me	i-Pr	Me	Me	3-Me-Ph	2.12
3.28	H	Me	Et	Me	Me	4-NO ₂ -Ph	1.92
3.29	H	Me	Et	Me	Me	4-MeO-Ph	1.93
3.30	H	Me	Et	Me	Me	3-MeO-Ph	2.02
3.31	H	Me	Et	Me	Me	3-Me-Ph	2.06
3.32	H	Me	i-Pr	Me	Me	cyclo-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 - 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	cyclo-Pr	1.65

Preparation example 3 - Process (b3) - compound (II) to compound (I): N'-4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidofornamide - compound 1.1



- 5 To a mixture of 2.0 g (6.9 mmol) of 4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylaniline and 11.3 ml (0.13 mol) of trimethoxymethane 0.12 g (0.7 mmol) of p-toluene sulfonic acid were added. The reaction mixture was refluxed for 16 hrs and concentrated *in vacuo*. The crude product was solved in 12 ml of toluene and 0.82 g (13.8 mmol) N-methylethanamine were added. The reaction mixture was stirred for 16 hrs at 50°C. The reaction mixture was
- 10 concentrated *in vacuo*. Column chromatographie (gradient: petroleum ether -> methyl-tert. butyl ether) yielded 2.3 g (6.3 mmol) 91 % of N'-4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidofornamide; log P (pH 2.3) = 2.04

Preparation example 4 - Process (b1) - compound (II) to compound (I): 4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethyl-N-[piperidin-2-ylidene]aniline - compound 1.25

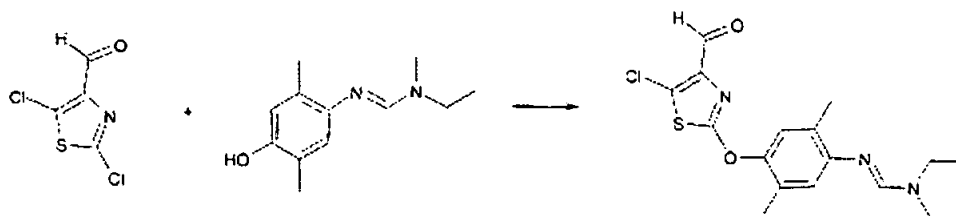


- A solution of 0.2g (1.5 mmol) of phosphoric trichloride in 5 ml toluene was added to a mixture of 0.3 g (3.0 mmol) of piperidin-2-one, the exothermic reaction was stirred for 2 hrs at ambient
- 20 temperature. Then a solution of 0.43 g (1.5 mmol) of 4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylaniline in 5 ml of toluene was added and the reaction mixture was refluxed for 5 hrs. At ambient temperature 5 ml of a 10% aqueous solution of sodium hydroxide was added. Separation of the layers, extraction of the watery layer with 10 ml of toluene, drying over magnesium sulfate, concentration *in vacuo* and Column chromatographie (gradient:
- 25 cyclohexane -> ethyl acetate) yielded 0.55g (1.5 mmol) 99 % of 4-[(4,5-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethyl-N-[piperidin-2-ylidene]aniline; log P (pH 2.3) = 1.97

Preparation example 5 - Process (c) - compound (I) to compound (I): N'-4-[(5-(N-allylethanimidoyl)-4-methyl-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidofornamide - compound 1.21

- 30

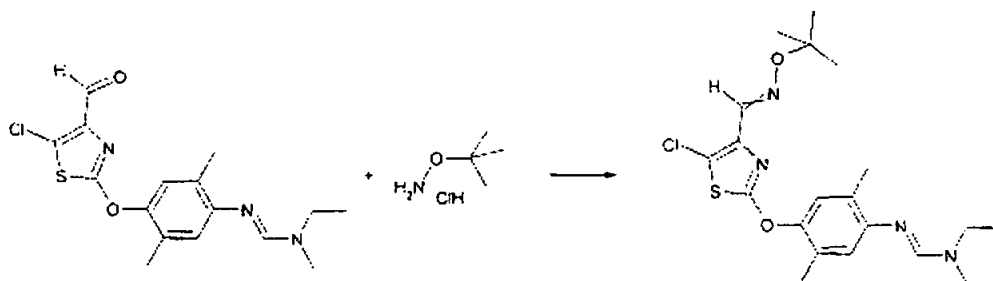
Preparation example 6 - Process (a) - compound (IV) and compound (IX) to compound (I): N'-{4-[(5-chloro-4-formyl-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl}-N-ethyl-N-methylimidoformamide - compound 1.42



- 5 To a solution of 3.57 g (17 mmol) of N-ethyl-N'-[4-hydroxy-2,5-dimethylphenyl]-N-methylimidoformamide in 60 ml of DMF were added 2.51 g (18 mmol) of potassium carbonate and the mixture was stirred at ambient temperature for 30 min. Then 3.00g (16.5 mmol) of 2,5-dichloro-1,3-thiazole-4-carbaldehyde were added and the mixture was stirred at ambient temperature for 7 days. Then the reaction mixture was poured on water, dichloromethane and some NaCl was added, layers were separated, the water layer was extracted with dichloromethane, the organic phase was dried over sodium sulfate and evaporated. Column chromatographie (gradient: dichloromethane -> methanol) yielded 4.40 g (12.5 mmol) 67 % of N'-{4-[(5-chloro-4-formyl-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl}-N-ethyl-N-methylimidoformamide log P (pH 2.3) = 1.51

15

Preparation example 7 - Process (c): N'-[4-[(4-[(tert-butoxyimino)methyl]-5-chloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl]-N-ethyl-N-methylimidoformamide - compound 1.44



- 20 A solution of 0.23 g (0.50 mmol) of N'-{4-[(5-chloro-4-formyl-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimethylphenyl}-N-ethyl-N-methylimidoformamide and 63 mg (0.50 mmol) of 2-(aminooxy)-2-methylpropane hydrochloride in a solvent mixture of 10 ml of methanol and 3 ml of water was stirred at ambient temperature for 5 days. Evaporation of the solvents and column chromatography of the crude mixture (gradient cyclohexane -> ethyl acetate) yielded 130 mg

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

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

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

10

In this test the following compounds according to the invention showed an efficacy of 70% or even higher at a concentration of 1000ppm of active ingredient: 1.1, 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.

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

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

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

- 20 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.

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

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

- 35 In this test, invention related compounds of the following formula revealed an efficacy of 70% or higher at a concentration of 500 ppm of active ingredient: 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.

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

Solvent: 24,5 parts by weight of acetone

24,5 parts by weight of dimethylacetamide

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

- Solvent: 24,5 parts by weight of acetone
24,5 parts by weight of dimethylacetamide
- 5 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.

10

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

15

humidity of 100 %.

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

20

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

In this test the compounds according to the invention of the following structures showed efficacy of 70% or even higher at a concentration of 100ppm of active ingredient: 1.2, 1.71, 1.72, 1.74, 1.75,

25

2.7.

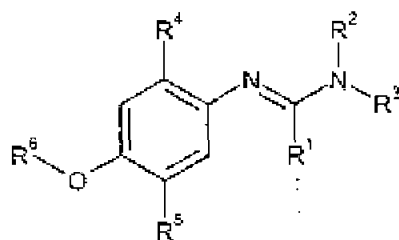
Efficacy example G : *Myzus persicae* – test; (MYZUPE spray application)

- Solvent: 78 parts by weight acetone
1.5 parts by weight dimethylformamide
- 30 Wetting agent: 0.5 parts by weight-alkylaryl polyglycolether

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

CLAIMS

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

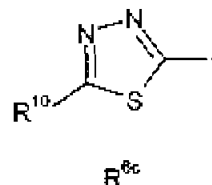
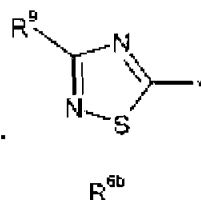
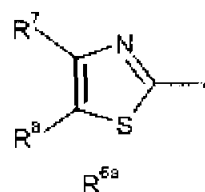


5

wherein

- R^1 represents H, a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkenyl, a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkynyl, SH or a substituted or non substituted S- C_1 - C_{12} -alkyl ;
- R^2 represents a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl ;
- R^3 represents a substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted C_3 - C_6 -cycloalkyl, substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkenyl, substituted or non substituted C_2 - C_{12} -alkynyl, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl ; or
- R^1 and R^2 , R^1 and R^3 or R^2 and R^3 can form together a substituted or non substituted 5- to 7-membered heterocycle ;
- R^4 represents a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a halogen atom, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted O- C_1 - C_{12} -alkyl or cyano ;
- R^5 represents H, a substituted or non substituted C_1 - C_{12} -alkyl, a halogen atom, halogeno- C_1 - C_{12} -alkyl, substituted or non substituted O- C_1 - C_{12} -alkyl or cyano ;
- R^6 represents a heterocycle selected in the list consisting of

20



25

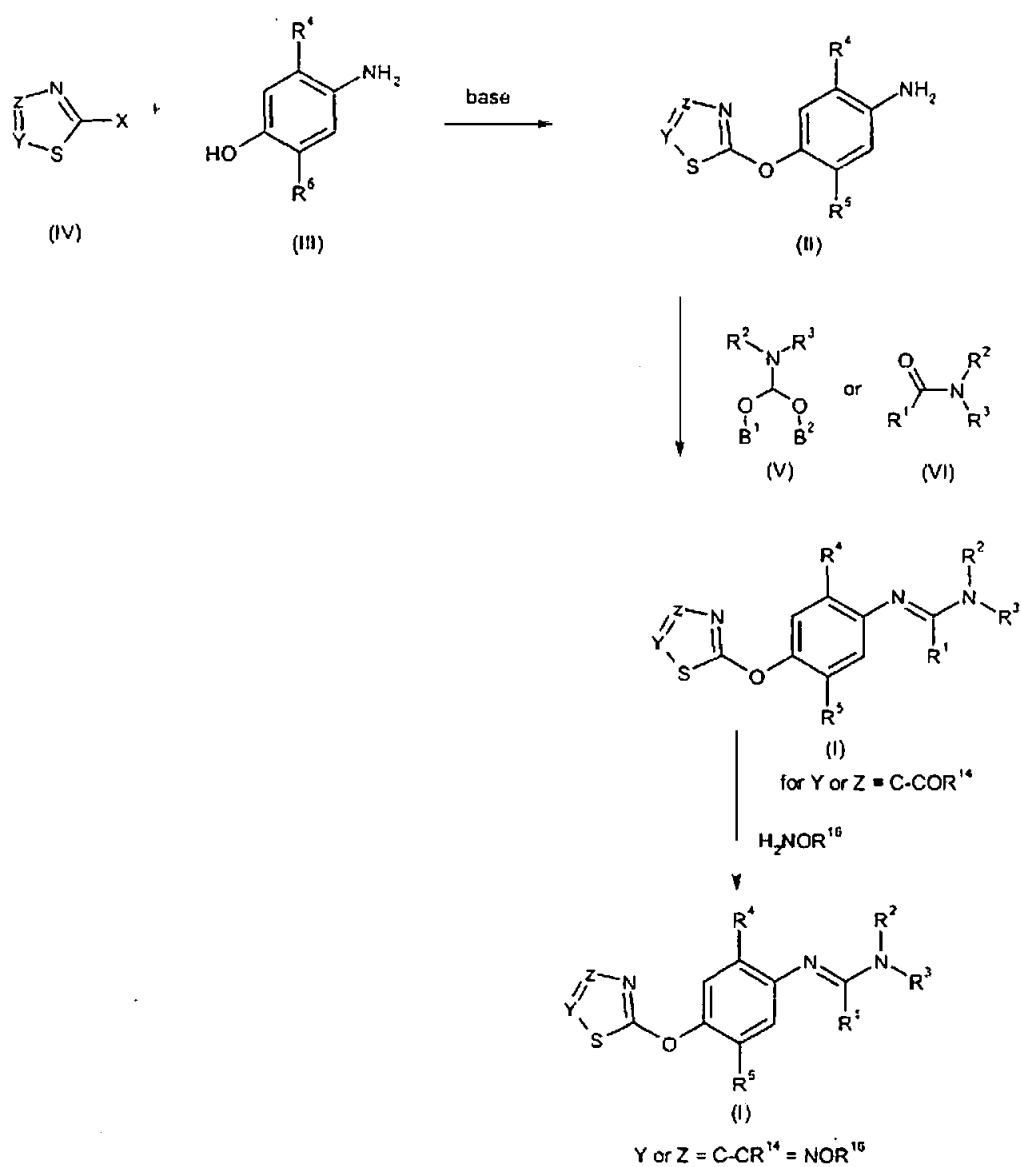
- R^7 represents H, halogen, nitro, cyano; substituted or non substituted phenyl, substituted or non substituted benzyl; C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -halogenalkyl, C_1 - C_6 -halogenalkoxy or C_1 - C_6 -halogenalkylthio; C_1 - C_6 -alkyl-S(O) $_m$ R^{11} ; C_1 - C_6 -alkyl-SO $_2$ NR ^{12} R ^{13} ; C_1 - C_6 -alkyl-COR ^{14} ; -CR ^{15} =N-O-R ^{16} ; S(O) $_m$ R ^{11} ; SO $_2$ NR ^{12} R ^{13} ; COR ^{14} ;
- R^8 represents H, halogen, cyano; substituted or non substituted phenyl, substituted or non substituted benzyl; C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -halogenalkyl, C_1 - C_6 -halogenalkoxy or C_1 - C_6 -halogenalkylthio; C_1 - C_6 -COR ^{14} ; -CR ^{15} =N-O-R ^{16} ; COR ^{14} ;

halogenoalkoxy; C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-halogenalkoxy or C₁-C₄-halogenalkylthio; C₁-C₄-S(O)_mR¹¹; C₁-C₄-SO₂NR¹²R¹³; C₁-C₄-COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, S(O)_mR¹¹, SO₂NR¹²R¹³, COR¹⁴; or

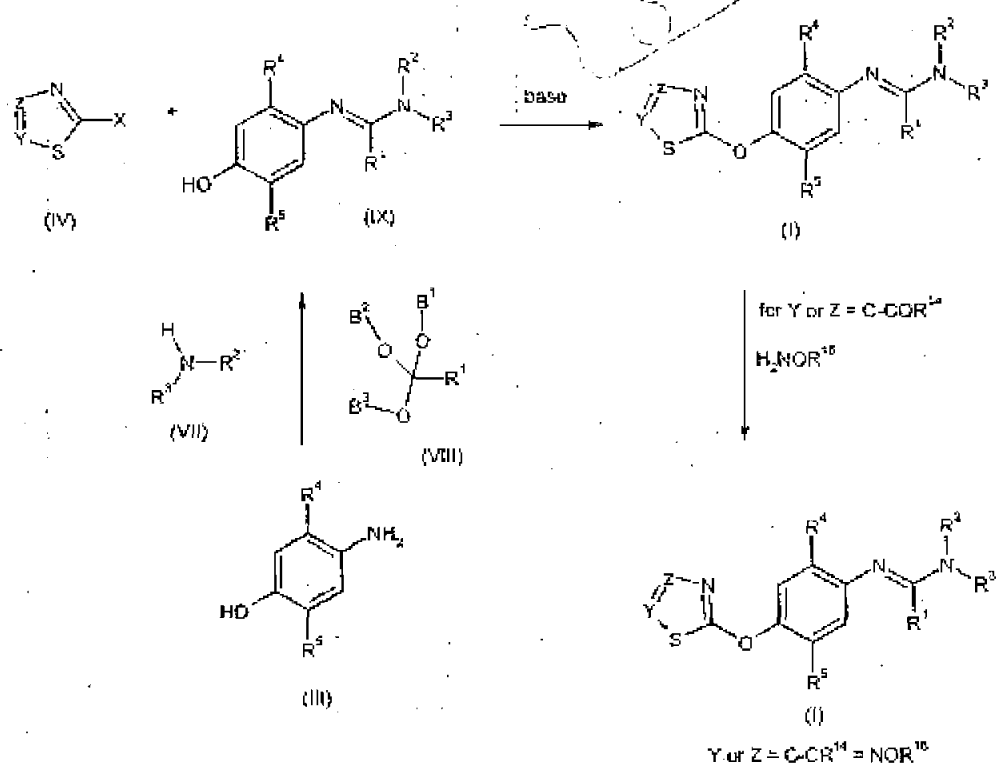
- R⁸ represents H, Cl, Br, I, cyano; phenyl; phenyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; benzyl; benzyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-halogenalkoxy or C₁-C₄-halogenalkylthio; C₁-C₄-COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, COR¹⁴; or
- R⁷ and R⁸ can form a carbocycle, which can be saturated, unsaturated or aromatic and substituted or non substituted by halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, or C₁-C₄-alkoxyalkyl; or
- R⁹ represents H, Cl, Br, I, cyano; phenyl; phenyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; benzyl; benzyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-halogenalkoxy or C₁-C₄-halogenalkylthio; C₁-C₄-COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, COR¹⁴; or
- R¹⁰ represents H, Cl, Br, I, cyano; phenyl; phenyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; benzyl; benzyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; pyridyl; pyridyl substituted by F, Cl, Br, I, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-halogenoalkoxy; C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-halogenalkoxy or C₁-C₄-halogenalkylthio; C₂-C₆-S(O)_mR¹¹; C₁-C₄-SO₂NR¹²R¹³; C₁-C₄-COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, S(O)_mR¹¹, SO₂NR¹²R¹³, COR¹⁴; or
- R¹¹ represents C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; or
- R¹² represents H, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; or
- R¹³ represents H, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; or
- R¹² and R¹³ can form a 5- or 6-membered heterocycle, which can further comprise one or more heteroatoms selected in the list consisting of O, N, S; or
- R¹⁴ represents H, branched or linear C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy; or
- R¹⁵ represents H, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; or
- R¹⁶ represents H, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, benzyl; benzyl substituted by halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl; or
- R¹⁵ and R¹⁶ can form a 5- or 6-membered heterocycle comprising further heteroatoms, like O, S, N.

3. A compound of formula (I) according to claims 1 or 2 wherein

- R¹ represents C₁-C₂₂-alkyl; or
- R³ represents a non substituted C₂-C₄-alkyl, C₃-C₄-alkenyl or cyclopropyl; or



8. A process for the preparation of a compound of formula (I) according to claims 1 to 6 comprising the following steps:



9. A method for controlling phytopathogenic fungi of crops, characterized in that an agronomically effective and substantially non-phytotoxic quantity of a compound according to claims 1 to 6 is applied to the soil where plants grow or are capable of growing, to the leaves or the fruit of plants or to the seeds of plants.

10. A method method for controlling damaging insects characterised in that a compound of formula (I) according to claims 1 to 6 is applied to the seed, the plant or to the fruit of the plant or to the soil wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.

DERIVADOS PLAGUICIDAS DE 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.

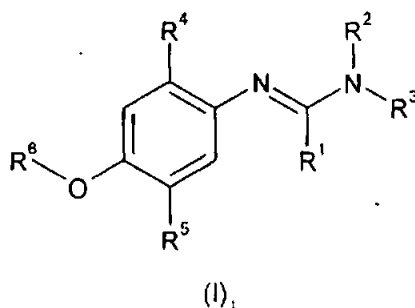
En la solicitud de patente internacional WO-00/46184 se describen varios derivados de fenilamidina. Sin embargo, este documento no describe o sugiere específicamente seleccionar tales compuestos en los que el anillo de fenilo está sustituido de acuerdo con la invención, permitiendo así una actividad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

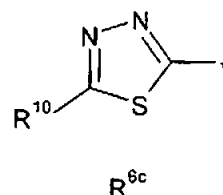
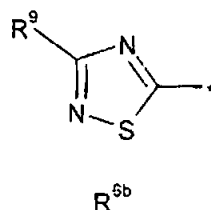
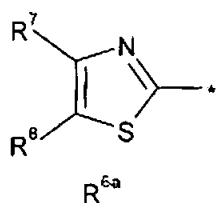
Por consiguiente, la presente invención provee derivados de amidina de fórmula (I):



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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; alquilo $C_1-C_8-COR^{14}$; $-CR^{15}=N-O-R^{16}$, COR^{14} ;
 - 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; 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_8 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 alcoxialquilo 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 R^{15} representa H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{16} representa H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , bencilo; bencilo sustituido con halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógeno-alquilo C_1-C_4 .

Incluso otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^{12} y R^{13} 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 R^{15} y R^{16} pueden formar un heterociclo de 5 ó 6 miembros que comprende otros heteroátomos, como O, S, N.

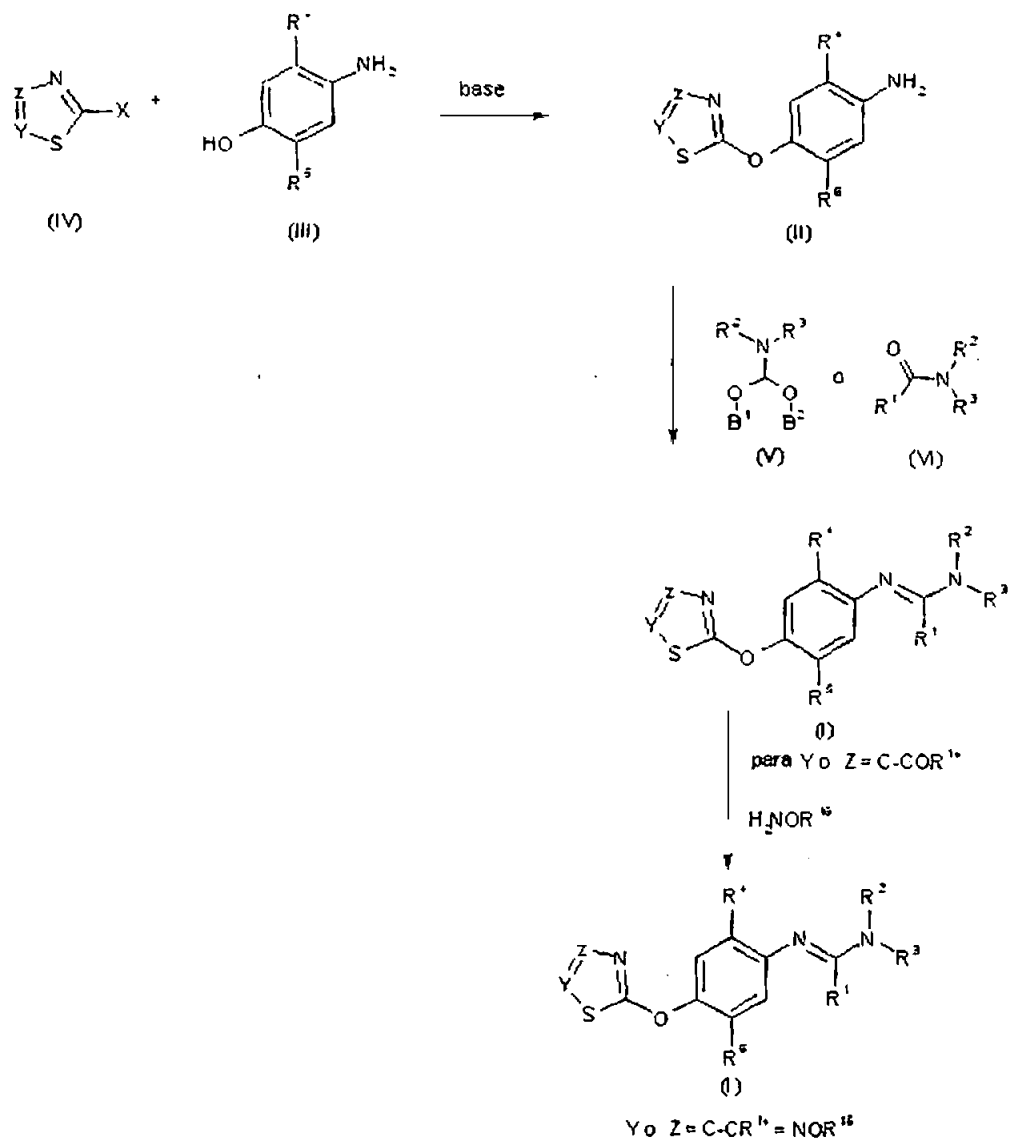
Las preferencias anteriormente mencionadas con relación a los sustituyentes de los compuestos según la invención pueden combinarse de varias formas. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan así subclases de compuestos según la invención.

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

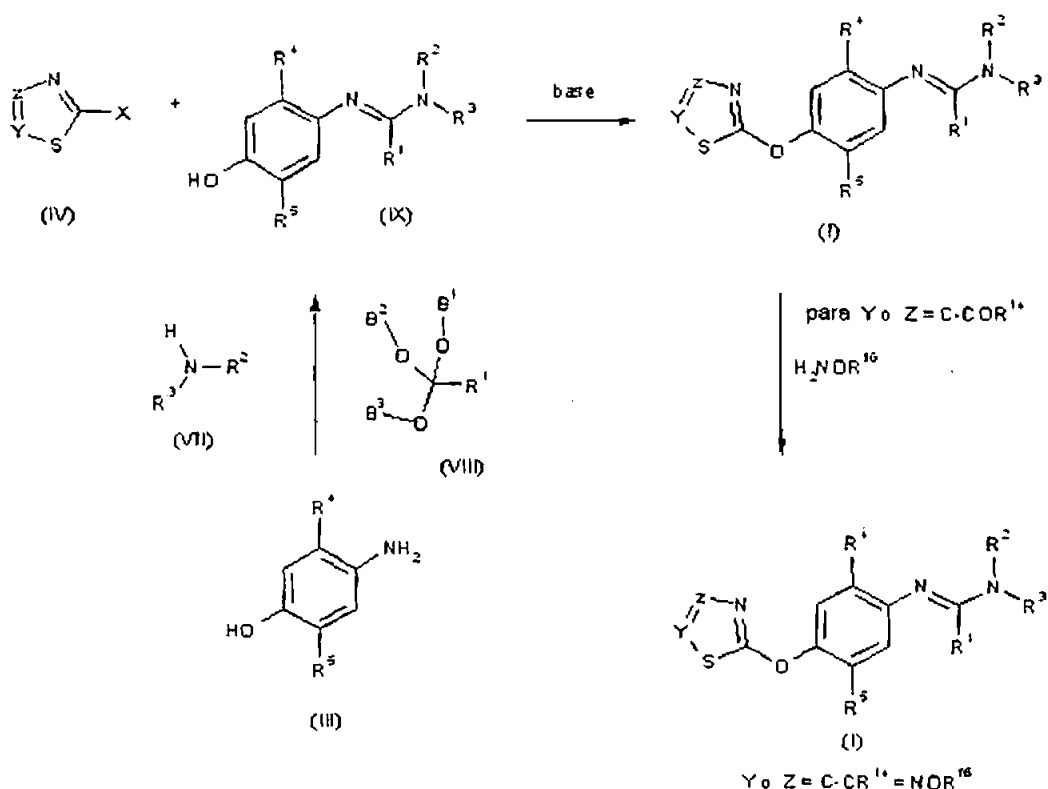
- características preferidas de R^1 con características preferidas de R^2 a R^5 o a R^{16} si corresponde;
- características preferidas de R^2 con características preferidas de R^1 a R^6 o a R^{16} si corresponde;
- características preferidas de R^3 con características preferidas de R^1 a R^6 o a R^{16} si corresponde;
- características preferidas de R^4 con características preferidas de R^1 a R^6 o a R^{16} si corresponde;
- características preferidas de R^5 con características preferidas de R^1 a R^6 o a R^{16} 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 R^1 a R^{11} 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.

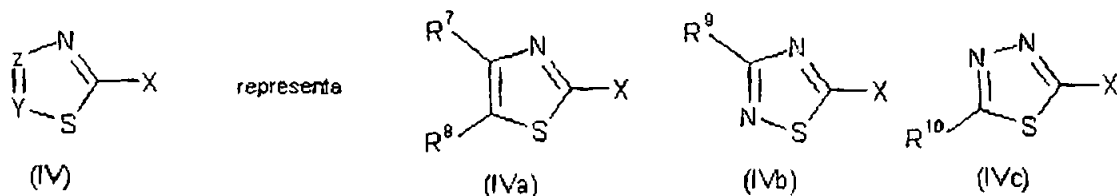


Esquema 1



Esquema 1a

En los esquemas 1 y 1a, fórmula (IV)



5

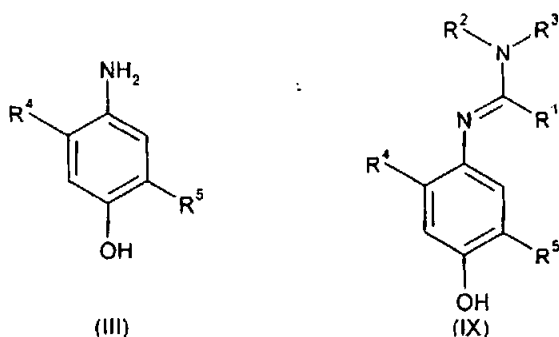
en las que

- Y representa $C-R^8$ (véase fórmula (IVa)), $C-R^{10}$ (véase fórmula (IVc)) o N (véase fórmula (IVb)),
- Z representa $C-R^7$ (véase fórmula (IVa)), $C-R^9$ (véase fórmula (IVb)) o N (véase fórmula (IVc)).
- R^7, R^8, R^9 y R^{10} son tal como se definen en la presente memoria,
- X representa halógeno, triflato, SOME, mesilato o tosilato.

10

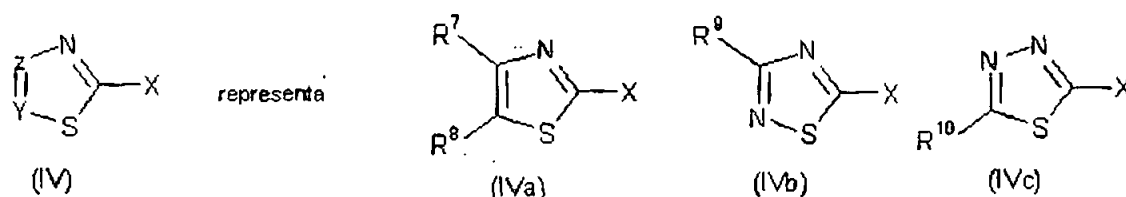
Por lo tanto, según otro aspecto de la invención, se provee un procedimiento (a) para la preparación de derivados de anilina de fórmulas (I) y (II), haciendo reaccionar derivados de aminofenol de fórmula (III) o derivados de amidina de fórmula (IX)

15



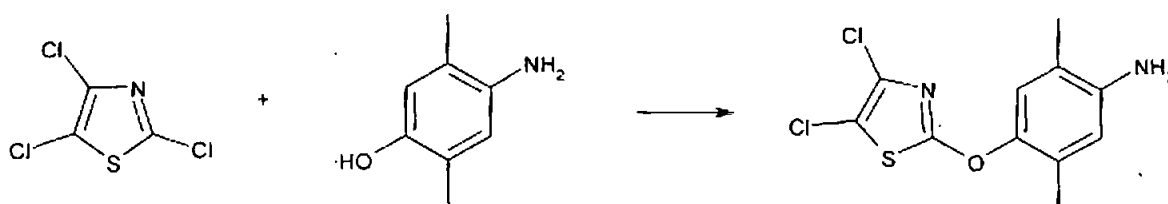
en las que

- R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 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, R^7, R^8, R^9 y R^{10} 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.

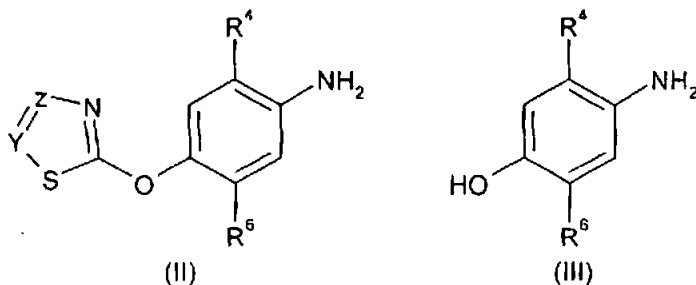
Las fórmulas (III) y (IX) proveen una definición general de los derivados de aminofenol o

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

según la invención. En esta fórmula, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , 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.

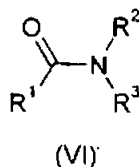
El procedimiento (b) según la invención comprende hacer reaccionar derivados de anilina de fórmulas (II) y (III) con diferentes reactivos, definiendo así los procedimientos (b1), (b2) y (3) respectivamente



en las que

- R^4 , R^6 , 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)



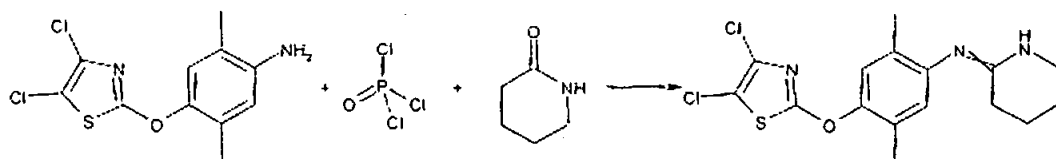
en la que

- R^1 , R^2 , R^3 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 PCl_5 , PCl_3 , $POCl_3$, $SOCl_2$;
- presencia de un diluyente.

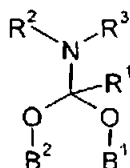
El procedimiento (b1) según la invención se lleva a cabo usando 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina, piperidín-2-ona y tricloruro fosfórico como materiales de partida. El procedimiento (b1) se puede llevar a cabo según el esquema 3.



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)

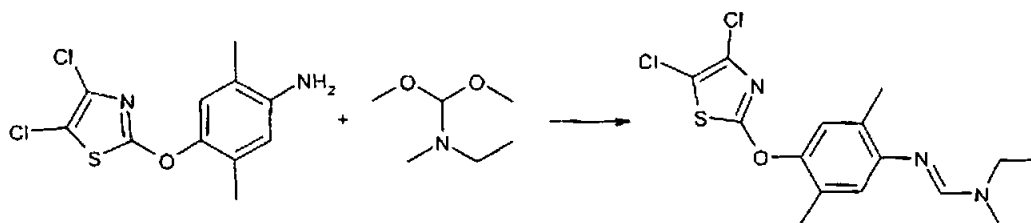
en la que

- 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.

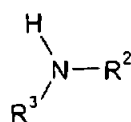
El procedimiento (b2) según la invención se lleva a cabo usando 4-[(4,5-dicloro-1,3-
 20 tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina y N-(dimetoximetil)-N-metiletanamina como materiales de
 partida. El procedimiento (b2) se puede llevar a cabo según el esquema 4.



Esquema 4

25

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

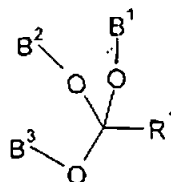


(VII)

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)

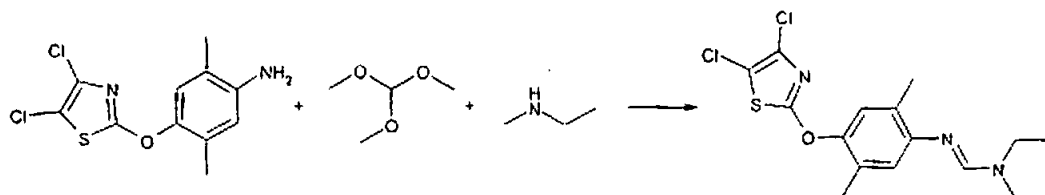
en la que

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

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.



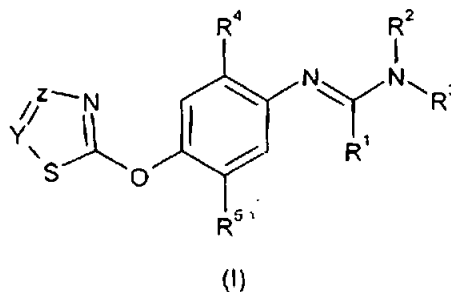
Esquema 5

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:

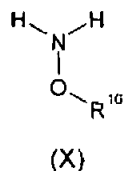
- presencia de un ácido o base;
- presencia de un diluyente.

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)



en la que

- Y o Z representan C-COR-₁₄ y R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son tal como se definen en la presente memoria con hidroxilaminas o sus sales, respectivamente



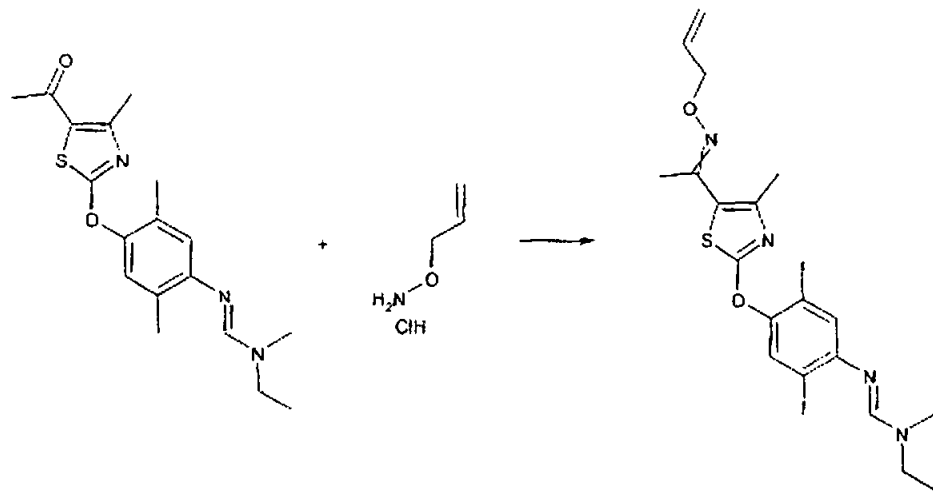
en la que R¹⁶ es tal como se define en la presente memoria.

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

- 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 (aminooxi)prop-1-eno como materiales de partida.

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 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 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 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 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, metoxietanol, dietilenglicol-monometiléter, dietilenglicolmonoetiléter; sus mezclas con agua o agua pura.

Los ligantes adecuados 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, diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de amonio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

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), trietilfosfina/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 sintoma 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, quiralexilo, clozilación, 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, tifulzamida;
- 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, hidrocloreto de kasugamicina hidratada, mepanipirim, pirimetanil;
- B7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señal como fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen;
- B8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membranas como clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotiolano, tolclofos-metilo, bifenilo, yodocarb, propamocarb, propamocarb-hidrocloreto;
- 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, tolilfluanid, zineb, ziram;
- B14) un compuesto seleccionado de la siguiente lista: amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicin, carvona, quinometionato, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofen, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotaí-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-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetileno)-bencenoacetato de metilo, 4-Cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[[[metilsulfonil]amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-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-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-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-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico.

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

El compuesto de fórmula (I) y la composición fungicida según la invención pueden usarse para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatógenos de las plantas o de los cultivos. Por lo tanto, de acuerdo con otro aspecto de la invención, se provee un método para controlar, en forma curativa o preventiva, los hongos fitopatógenos de plantas o cultivos caracterizado porque se aplica un compuesto de fórmula (I) o una composición fungicida según la invención a la semilla o 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.,
- 15 *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, árbol del plátano y plataneros), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp.
- 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 oidio, 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 albo-atrum*;
- 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 dyebark*, 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*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*;
- la clase de *Bivalva*, por ejemplo, *Dreissena* spp.;
- la clase de *Chilopoda*, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;
- la clase de *Coleoptera*, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorrhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Heteronychus arator*, *Hylamorphia elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissonotus oryzae*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.;
- la clase de *Collembola*, por ejemplo, *Onychiurus armatus*;
- la clase de *Dermaptera*, por ejemplo, *Forficula auricularia*;
- la clase de *Diplopoda*, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*;
- la clase de *Diptera*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila*

spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hypo-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* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphylobothrium 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*,
- 10
 - 15 *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *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*, *Cavalerius* 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., *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* 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 kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*;
- 20 *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Ho-f-manno-phila pseudospetella*, *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 gemmatilis*;
- 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, *Scutigereila immaculata*;
- la clase de *Thysanoptera*, por ejemplo, *Ballothrips 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., *Belonolaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globo-dera* spp., *Helicocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus*

- spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp;
- los escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosus*, *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 capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon* spec. *Dinoderus minutus*;
 - *Hymenopterans*, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*,
 - 10 *Urocerus augur*;
 - termitas, tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santoniensis*, *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* spp., *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*, *Chrysosoma 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 como 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*.

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

En los siguientes ejemplos, los valores logP se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C 18), usando el método descrito a continuación:

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).

Los valores máx de lambda se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 190nm a 400nm.

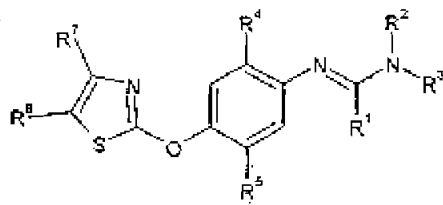


Tabla 1:

No	R2	R3	R1	R4	R5	R7	R8	log p (HCO CH)
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	2.78
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	2.26
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	CMc=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	CMc=NO-Me	1.97
1.20	Me	Et	H	Me	Me	iPr	Cl	2.52
1.21	Me	Et	H	Me	Me	Me	CMc=NO-CH2CH=CH2	2.33
1.22	-CH2CH2CH2CH2CH2CH3-		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	CMc=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	n-Pr	2.29
1.36	Me	Et	H	Me	Me	Me	n-Pr	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	CMc=NOH	1.55
1.41	Me	iPr	H	Me	Me	Me	CMc=NOH	1.66
1.42	Me	Et	H	Me	Me	CHO	Cl	1.46
1.43	Me	Et	H	Me	Me	CH=NO-Me	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	2.28
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	CMc=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=NO-Me	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	1,58
1.64	Me	iPr	H	Me	Me	tBu	Cl	2,79
1.65	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	tBu	Cl	3,06
1.66	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	Cl	4-Cl-Ph	2,97
1.67	Me	Et	H	Me	Me	-COI=CH-CH=CH		2,17
1.68	-CH2CH2CH2CH2CH2-		H	Me	Me	-COI=CH-CH=CH		2,34
1.69	Me	nPr	H	Me	Me	-COI=CH-CH=CH		2,29
1.70	Me	iPr	H	Me	Me	-COI=CH-CH=CH		2,40
1.71	Me	Et	H	Me	Me	tBu	Br	2,79
1.72	Me	Et	H	Me	Me	CN	Cl	1,74
1.73	Me	Et	H	Me	Me	Cl	tBu	2,67
1.74	Me	Et	H	Me	Me	H	tBu	2,18
1.75	Me	Et	H	Me	Me	tBu	H	2,26

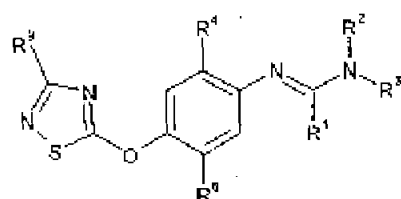


Tabla 2:

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

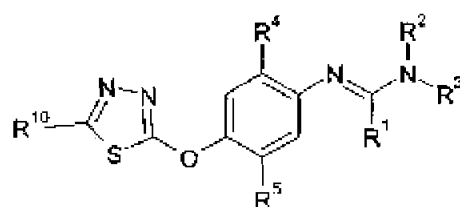


Tabla 3:

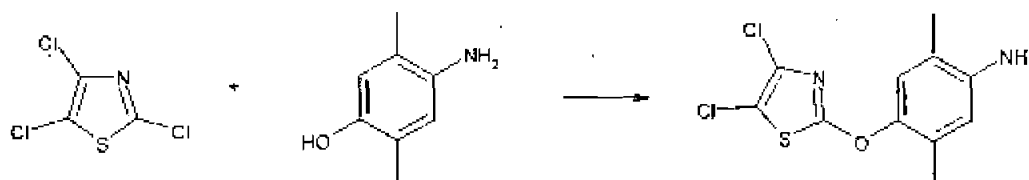
No	R1	R2	R3	R4	R5	R10	logP (HCOOH)
3.1	H	Me	i-Pr	Me	Me	CF3	1,84
3.2	H	Me	Et	Me	Me	CF3	1,78
3.3	H	Me	Et	Me	Me	Ph	1,93
3.4	H	Me	Et	Me	Me	2-F-6-OMe-Ph	1,87

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

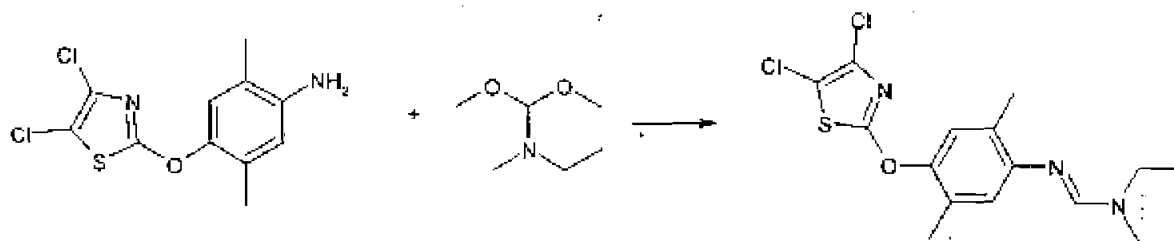
Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitativa la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

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)



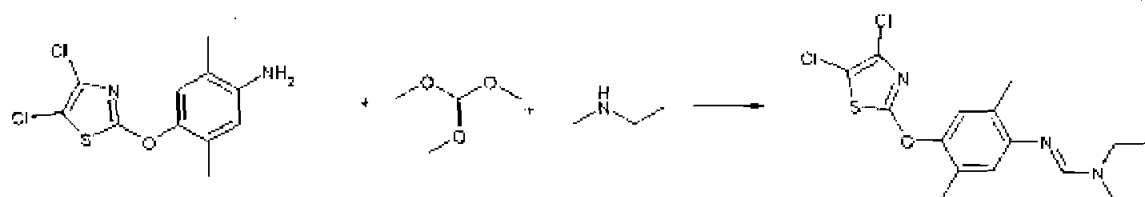
Se añadieron 1,3 g (33 mmol) (60% en aceite) en porciones a una disolución de 4,1 g (30,0 mmol) de 4-amino-2,5-dimetilfenol en 30 ml de dimetilformamida. Después de que cesó la evolución gaseosa, se añadieron 5,6 g (30 mmol) de 2,4,5-tricloro-1,3-tiazol y la mezcla de reacción se agitó durante 1 h a 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-dimetilfenilina 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



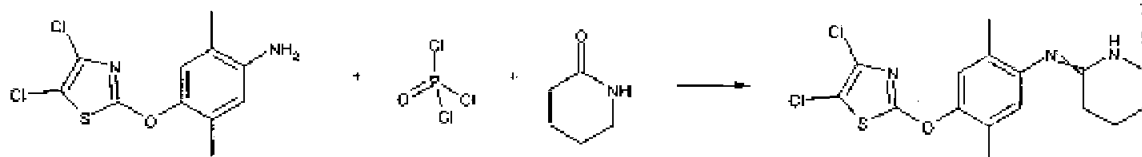
A una mezcla de 2,0 g (6,9 mmol) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenilina en 2,5 ml tolueno, se le añadió una disolución de 9,7 mmol en N-(dimetoximetil)-N-metiletanamina (60% en metanol). La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a 105 °C. La mezcla de reacción se concentró *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



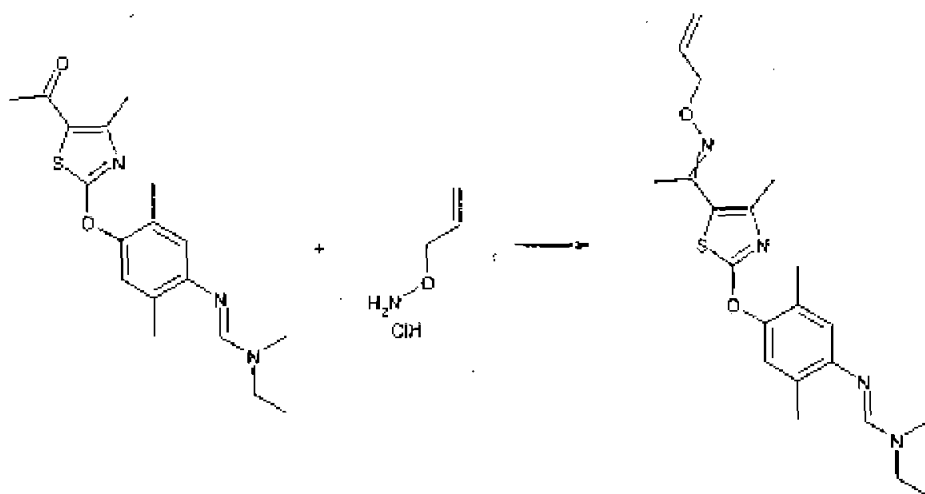
A una mezcla de 2,0 g (6,9 mmol) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina y 11,3 ml (0,13 mol) de trimetoximetano se le añadieron 0,12 g (0,7 mmol) de ácido p-tolueno sulfónico. La mezcla de reacción se sometió a reflujo durante 16 horas y se concentró *in vacuo*. El producto bruto 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-iden]anilina – compuesto 1.25



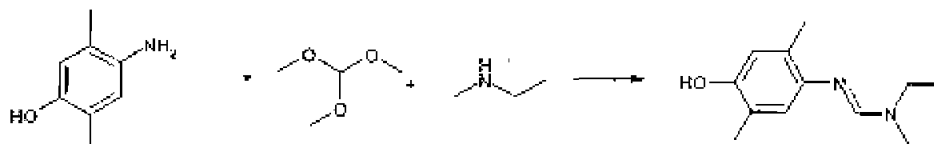
Se añadió una disolución de 0,2 g (1,5 mmol) de tricloruro fosfórico en 5 ml de tolueno a una mezcla de 0,3 g (3,0 mmol) de piperidin-2-ona, la reacción exotérmica se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Luego se añadió una disolución de 0,43 g (1,5 mmol) de 4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilanilina 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-iden]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



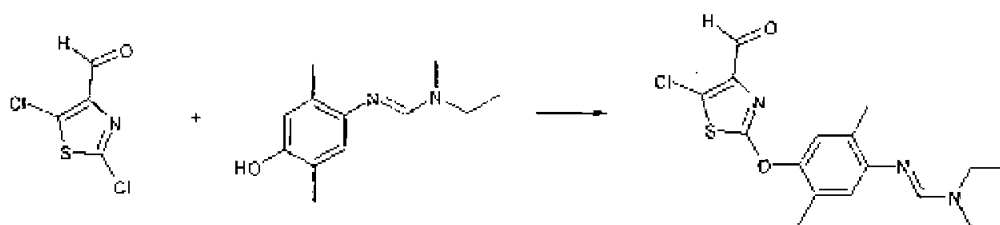
Se agitó una disolución de 0,3 g (0,87 mmol) de hidrocloreto de N'-(4-((5-acetil-4-metil-1,3-tiazol-2-il)oxi)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida y 0,095 g (0,87 mmol) de 3-(aminooxi)prop-1-eno en una mezcla disolvente de 10 ml de metanol y 3 ml de agua a temperatura ambiente durante 5 días. 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)



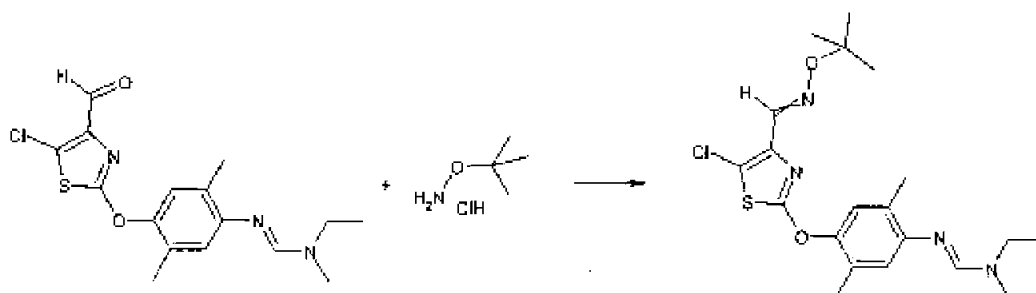
A una mezcla de 10,0 g (73 mmol) de 4-amino-2,5-dimetilfenol y 73 ml (0,84 mol) de trimetoximetano se le añadieron 0,73 g (4,2 mmol) de ácido p-tolueno sulfónico y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Luego los volátiles se eliminaron *in vacuo* y el residuo se disolvió en 73 ml de tolueno 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 hidrocioruro 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 pustulas 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* (oidio en cebada)

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

Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

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

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

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 pustulas 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 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 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%.

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 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, 15 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
20 24,5 partes en peso de dimetilacetamida
Emulsificante: 1 parte en peso de alquilaryl poliglicol éter

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

25 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%.

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: 1.1, 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, 35 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 alquilaryl poliglicol éter

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

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
15 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 alquilaryl 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
25 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
35 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 alquilarylpoliglicoléter

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 HELVI)

Disolvente:	78 partes en peso de acetona
	1,5 partes en peso de dimetilformamida
Agente humectante	0,5 parte en peso de alquilariilpoliglicoléter

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.

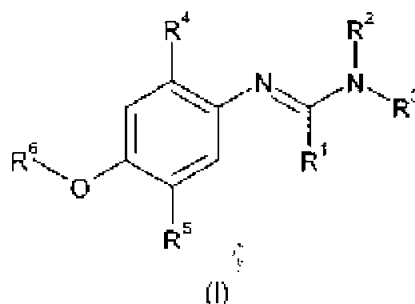
Se rocían cortes de hoja de soja (*Glycine max.*) con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secos, los cortes de hoja se infestan con huevos de gusano del algodón (*Heliotis virescens*).

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.

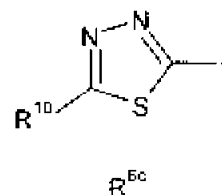
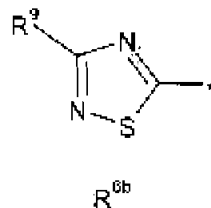
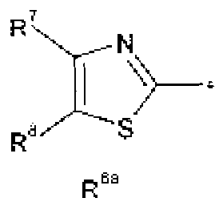
REIVINDICACIONES

1. Un derivado de fenilammina de fórmula (I);



5 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;
- 10 • R^3 representa un alquilo C_2-C_{12} sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C_3-C_8 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;
- 15 • R^4 representa un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un átomo de halógeno, halógeno-alquilo C_1-C_{12} , O-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido o ciano;
- R^5 representa un H, un alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido, un átomo de halógeno, halógeno-alquilo C_1-C_{12} , O-alquilo C_1-C_{12} sustituido o no sustituido o ciano;
- R^6 representa un heterociclo seleccionado de la lista que consiste en



20

- 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; 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 • 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; alquilo C_1-C_8 -COR¹⁴, -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, COR¹⁴;
 - 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_8 , halógeno-alcoxi C_1-C_8 o halógeno-alquiltio C_1-C_8 ; alquilo C_1-C_8 -S(O)_mR¹¹; alquilo C_1-C_8 -SO₂NR¹²R¹³; alquilo C_1-C_8 -COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, S(O)_mR¹¹, SO₂NR¹²R¹³, COR¹⁴;
 - 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;
 - 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.

2. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

- R^1 representa H, alquilo C_1-C_{12} o SH; o
- R^2 representa metilo; o
- R^3 representa alquilo C_2-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} ; cicloalquilo C_3-C_6 ; o
- R^2 y R^3 pueden formar juntos un heterociclo de 5 a 7 miembros sustituido o no sustituido; o
- R^4 representa alquilo C_1-C_{12} , un átomo de halógeno o trifluorometilo; o
- R^5 representa H, alquilo C_1-C_{12} , un átomo de halógeno o trifluorometilo; o
- 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 C₁-C₄; alquilo C₁-C₄ -S(O)_mR¹¹; alquilo C₁-C₄ -SO₂NR¹²R¹³; alquilo C₁-C₄ -COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, S(O)_mR¹¹, SO₂NR¹²R¹³, COR¹⁴; o
- R⁸ representa H, Cl, Br, I, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, halógeno-alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alquiltio C₁-C₄; alquilo C₁-C₄ -COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, COR¹⁴; o
 - R⁷ y R⁸ pueden formar un carbociclo, que puede ser saturado, insaturado o aromático y no sustituido o sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄ o alcoxialquilo C₁-C₄; o
 - R⁹ representa H, Cl, Br, I, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, halógeno-alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alquiltio C₁-C₄; alquilo C₁-C₄ -COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, COR¹⁴; o
 - R¹⁰ representa H, Cl, Br, I, ciano; fenilo; fenilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; bencilo; bencilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; piridilo; piridilo sustituido con F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alcoxi C₁-C₄; alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, halógeno-alquilo C₁-C₄, halógeno-alcoxi C₁-C₄ o halógeno-alquiltio C₁-C₄; alquilo C₁-C₄ -S(O)_mR¹¹; alquilo C₁-C₄ -SO₂NR¹²R¹³; alquilo C₁-C₄ -COR¹⁴; -CR¹⁵=N-O-R¹⁶, S(O)_mR¹¹, SO₂NR¹²R¹³, COR¹⁴; o
 - R¹¹ representa alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆; o
 - R¹² representa H, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆; o
 - R¹³ representa H, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆; o
 - R¹² y R¹³ 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; o
 - R¹⁴ representa H, alquilo C₁-C₈ lineal o ramificado, alcoxi C₁-C₅; o
 - R¹⁵ representa H, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆; o
 - R¹⁶ representa H, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, bencilo; bencilo sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄ o halógeno-alquilo C₁-C₄; o
 - R¹⁵ y R¹⁶ pueden formar un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, que comprende otros heteroátomos, como O, S, N.
3. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2, en el que
- R¹ representa alquilo C₁-C₁₂; o
 - R³ representa un alquilo C₂-C₄ no sustituido, alqueno C₃-C₄ o ciclopropilo; o
 - R² y R³ pueden formar juntos un heterociclo de 6 miembros; o

- R^4 representa un alquilo C_1-C_{12} no sustituido, un átomo de cloro o flúor; o
- R^5 representa un alquilo C_1-C_{12} no sustituido, un átomo de cloro o flúor.

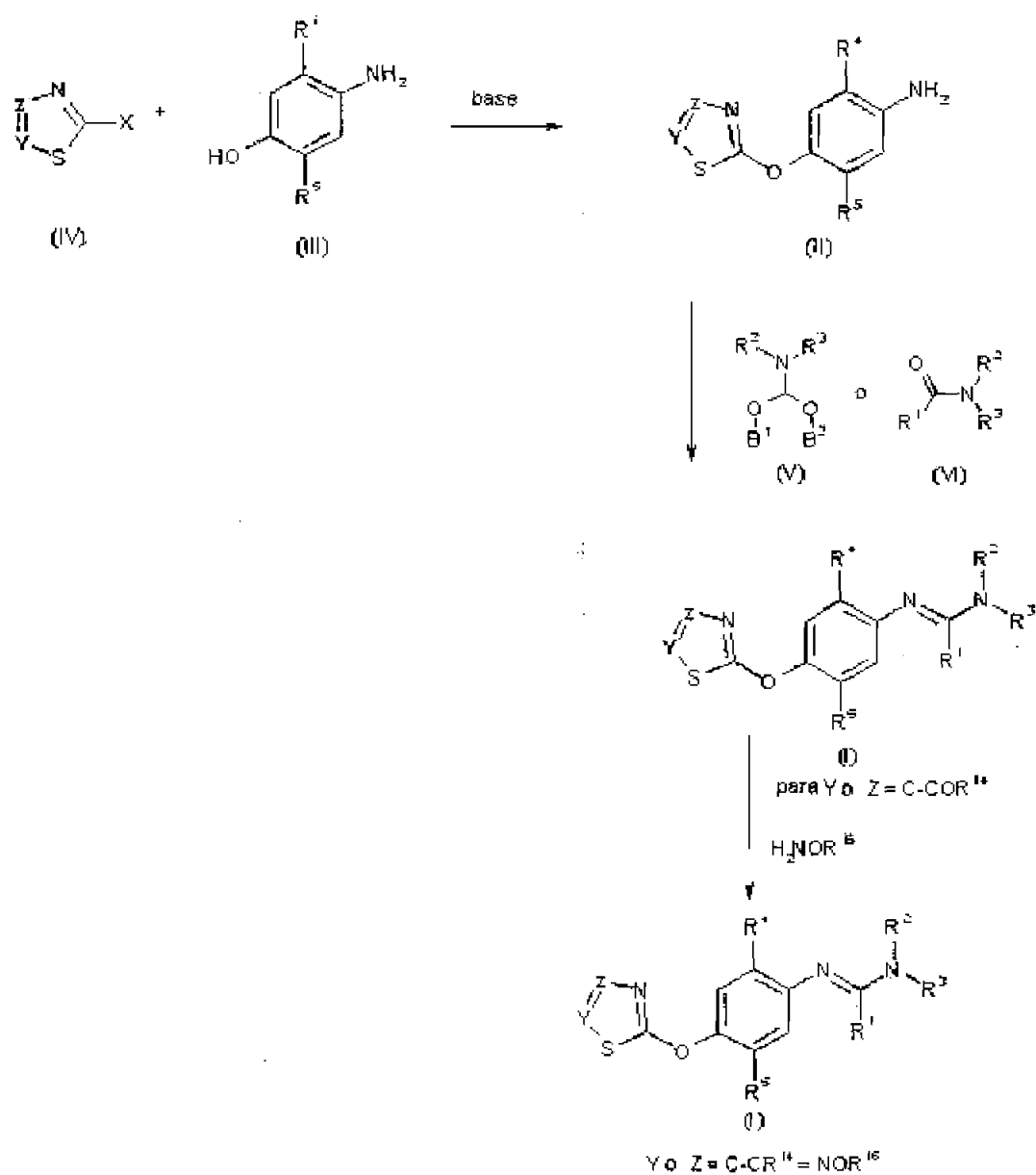
4. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, en el que

- 5
- R^1 representa metilo; o
 - R^3 representa etilo, n-propilo, i-propilo, propenilo o alilo; o
 - R^2 y R^3 pueden formar juntos un piridinilo o un pirolidinilo; o
 - R^4 representa metilo y etilo; o
 - R^5 representa metilo o etilo.

10 5. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 4, en el que R^2 y R^3 forman juntos un pirolidinilo 2-alquilado.

6. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 5, en el que R^2 y R^3 forman juntos un 2-metil-pirolidinilo.

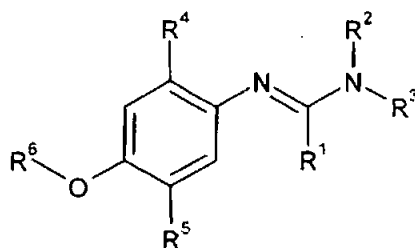
15 7. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, que comprende las siguientes etapas:



8. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, que comprende las siguientes etapas:

RESUMEN

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



(I)

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066273

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

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

Date of mailing (day/month/year) 31 January 2007 (31.01.2007)	
Applicant's or agent's file reference BCS 05-4027	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2006/066273	International filing date (day/month/year) 12 September 2006 (12.09.2006)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 13 September 2005 (13.09.2005)
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG et al	

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

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
13 September 2005 (13.09.2005)	05356155.1	EP	09 January 2007 (09.01.2007)

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

Authorized officer

Yolaine Cussac

Facsimile No. +41 22 338 90 84

Telephone No. +41 22 338 90 12

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Form PCT/IB/304 (October 2005)

1/C4Y9WSNX0

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference BCS 06-4027	FOR FURTHER ACTION		See item 4 below
International application No. PCT/EP2006/066273	International filing date (day/month/year) 12 September 2006 (12.09.2006)	Priority date (day/month/year) 13 September 2005 (13.09.2005)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant BAYER CROSCIENCE AG			

1. This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44bis.1(a).

2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.

In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.

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

- | | | |
|-------------------------------------|--------------|---|
| ☒ | Box No. I | Basis of the report |
| ☐ | Box No. II | Priority |
| ☐ | Box No. III | Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability |
| ☐ | Box No. IV | Lack of unity of invention |
| ☒ | Box No. V | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement |
| ☐ | Box No. VI | Certain documents cited |
| ☐ | Box No. VII | Certain defects in the international application |
| ☐ | Box No. VIII | Certain observations on the international application |

4. The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis.2).

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 83 70	Date of issuance of this report 18 March 2008 (18.03.2008)
	Authorized officer Agnes Wittmann-Regis e-mail: pe06.per@wipo.int

PATENT COOPERATION TREATY

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

To:

see form PCT/ISA/220

PCT

WRITTEN OPINION OF THE INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY (PCT Rule 43bis.1)

Date of mailing
(day/month/year) see form PCT/ISA/210 (second sheet)

Applicant's or agent's file reference
see form PCT/ISA/220

FOR FURTHER ACTION
See paragraph 2 below

International application No.
PCT/EP2006/066273

International filing date (day/month/year)
12.09.2006

Priority date (day/month/year)
13.09.2005

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

INV. C07D277/34 C07D277/56 C07D277/68 C07D417/12 C07D285/125 C07D285/08 A01N43/78 A01N43/82
A01N43/84 A01P3/00 A01P7/04

Applicant
BAYER CROPSCIENCE AG

1. This opinion contains indications relating to the following items:

- ☒ Box No. I Basis of the opinion
- ☐ Box No. II Priority
- ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
- ☒ Box No. V Reasoned statement under Rule 43bis.1 (a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- ☐ Box No. VI Certain documents cited
- ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
- ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

2. **FURTHER ACTION**

If a demand for international preliminary examination is made, this opinion will usually be considered to be a written opinion of the International Preliminary Examining Authority ("IPEA") except that this does not apply where the applicant chooses an Authority other than this one to be the IPEA and the chosen IPEA has notified the International Bureau under Rule 66.1bis(b) that written opinions of this International Searching Authority will not be so considered.

If this opinion is, as provided above, considered to be a written opinion of the IPEA, the applicant is invited to submit to the IPEA a written reply together, where appropriate, with amendments, before the expiration of 3 months from the date of mailing of Form PCT/ISA/220 or before the expiration of 22 months from the priority date, whichever expires later.

For further options, see Form PCT/ISA/220.

3. For further details, see notes to Form PCT/ISA/220.

Name and mailing address of the ISA:



European Patent Office - P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas
Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl
Fax: +31 70 340 - 3016

Date of completion of
this opinion

see form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

Allard, Michel

Telephone No. +31 70 340-2002



**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/EP2006/066273

Box No. I Basis of the opinion

1. With regard to the **language**, this opinion has been established on the basis of:
 - ☒ the international application in the language in which it was filed
 - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1 (b)).
2. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application and necessary to the claimed invention, this opinion has been established on the basis of:
 - a. type of material:
 - ☐ a sequence listing
 - ☐ table(s) related to the sequence listing
 - b. format of material:
 - ☐ on paper
 - ☐ in electronic form
 - c. time of filing/furnishing:
 - ☐ contained in the international application as filed.
 - ☐ filed together with the international application in electronic form.
 - ☐ furnished subsequently to this Authority for the purposes of search.
3. ☐ In addition, in the case that more than one version or copy of a sequence listing and/or table relating thereto has been filed or furnished, the required statements that the information in the subsequent or additional copies is identical to that in the application as filed or does not go beyond the application as filed, as appropriate, were furnished.
4. Additional comments:

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/EP2006/066273

Box No. V Reasoned statement under Rule 43b/s.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	5, 6, 10
	No: Claims	1-4, 7-9
Inventive step (IS)	Yes: Claims	10
	No: Claims	1-9
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-10
	No: Claims	-

2. Citations and explanations

see separate sheet

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/066273

Re Item V.

Reference is made to the following document:

D1 : WO 00/46184 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 10 August 2000 (2000-08-10) cited in the application

Novelty (Article 33(2) PCT)

The subject-matter of claims 1-4 and 7-9 lacks novelty in the light of the disclosure of D1, see in particular compounds 48, 66, 68, 72, 81-84, 86, 113, 116, 117, 119, 120, 123, 138, 194-197, 206-209, 215-217, 225, 234, 246, 247, 252-254, 259, 298-300, 336-339, 351, 356, 362, 368, 383 and 611.

The available prior art does not disclose compound of formula (I) according to the present application wherein R^2 and R^3 form together with the nitrogen atom to which they are attached a 2-alkylated pyrrolidine, nor does it disclose the use of compounds (I) as insecticides: the subject-matter of claims 5, 6 and 10 is therefore novel.

Inventive step (Article 33(3) PCT)

The subject-matter of claims 1-4 and 7-9 which lacks novelty does not offer a basis for acknowledging an inventive step.

The subject-matter of claims 5 and 6, and any novel subject-matter of claims 1-4 and 7-9 lacks an inventive step in as far as it is directed to the provision of further fungicidal compounds, because it merely represents a selection within the compounds already suggested in D1 for said use.

The subject-matter of claim 10 involves an inventive step because the available prior art does not suggest the use of the compounds (I) as insecticides.

Industrial applicability (Article 33(4) PCT)

104

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/066273

The compounds and processes of claims 1-10 can be used in the agrochemical industry.

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066273

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

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

Date of mailing (day/month/year) 07 March 2008 (07.03.2008)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference BCS 05-4027	
International application No. PCT/EP2006/066273	International filing date (day/month/year) 12 September 2006 (12.09.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

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

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

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

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

3. Further observations, if necessary:

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

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

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

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Form PCT/IB/306 (October 2005)

1/DKWGE33Q2

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066273

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BALMEFREZOL, Ludovic
BAYER CROPSCIENCE SA
Patents & Licensing Department
14-20 Rue Pierre Baizel
F-69009 Lyon
FRANCEDate of mailing (day/month/year)
07 March 2008 (07.03.2008)Applicant's or agent's file reference
BCS 05-4027International application No.
PCT/EP2006/066273

IMPORTANT NOTIFICATION

International filing date (day/month/year)
12 September 2006 (12.09.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representativeName and Address
MORADI, Wahed
Gerstenkamp 12
51061 Köln
GermanyState of Nationality
DEState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

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

☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residenceName and Address
MORADI, Wahed
Maria-Merian Strasse 7
40789 Monheim an Rhein
GermanyState of Nationality
DEState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

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

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

Authorized officer

Blanc Veronique

Facsimile No. +41 22 338 82 70

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

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/066273

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BALMEFREZOL, Ludovic
BAYER CROPSCIENCE SA
Patents & Licensing Department
14-20 Rue Pierre Baizel
F-69009 Lyon
FRANCEDate of mailing (day/month/year)
07 March 2008 (07.03.2008)Applicant's or agent's file reference
BCS 05-4027

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP2006/066273International filing date (day/month/year)
12 September 2006 (12.09.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

HARTMANN, Benoit
Färberstrasse 1
40764 Langenfeld
GermanyState of Nationality
FRState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

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

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

Name and Address

HARTMANN, Benoit
12 chemin Antoinette
F-69110 Sainte Foy-lès-Lyon
FranceState of Nationality
FRState of Residence
FR

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

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

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

Authorized officer

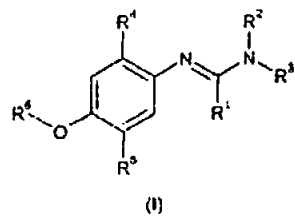
Blanc Veronique

Facsimile No. +41 22 338 82 70

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

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07D 277/34, A01N 43/78, A01N 43/82, A01N 43/84, A01P 3/00, A01P 7/04, C07D 277/56, C07D 277/68, C07D 285/08, C07D 285/125, C07D 417/12	
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG	
(30) Prioridad	(31) No. 05356155.1	32) Fecha 13/09/05	(33) País US
		(72) Inventor(es) KUNZ, KLAUS GREUL, JÖRG y otros	
		(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ	
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 13/04/08		(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 22/03/07	
Fecha de presentación de la solicitud: 12/09/06		N° publicación: WO/2007/031513	
No. de solicitud PCT/EP2006/066273			
(54) Titulo: DERIVADOS PLAGUICIDAS DE FENILAMIDA SUSTITUIDA CON TIAZOLILOXI			

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





Industria y Comercio

SUPERINTEND

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-034065- -00000-0000

Fecha: 2008-04-04 18:29:51 Dep. 2020 NUECREACION!
Tra 11 PATENTE/II Eve: 378 FASENACIONAL
Act. 411 PRESENTACION Folios: 110

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

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

Firma Responsable:

[Handwritten Signature]

Fecha:

April 4, 2008

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CORREA ORDÓÑEZ ALVARO

REFERENCIA	Radicación No.	8 34065
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/0066273
	Fecha inicio fase nacional	13/04/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	5961

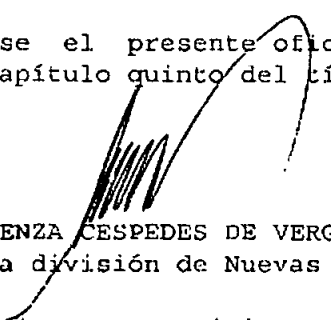
Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se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

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

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

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

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


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

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