



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 351 228**

51 Int. Cl.:
C07D 277/20 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **06755210 .9**
96 Fecha de presentación : **16.05.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **1888545**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **20.02.2008**

54 Título: **Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos.**

30 Prioridad: **18.05.2005 DE 10 2005 023 606**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.02.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.02.2011

73 Titular/es: **BASF SE**
67056 Ludwigshafen, DE

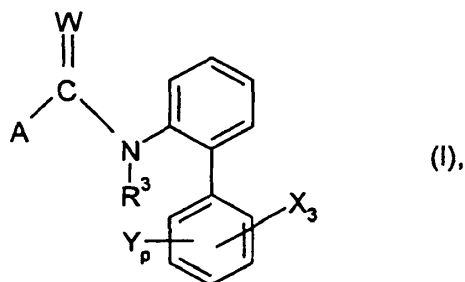
72 Inventor/es: **Rheinheimer, Joachim;**
Lohmann, Jan Klaas;
Gewehr, Markus;
Schafer, Peter;
Dietz, Jochen;
Renner, Jens;
Muller, Bernd;
Grammenos, Wassilios;
Grote, Thomas;
Hunger, Udo;
Schwogler, Anja y
Schieweck, Frank

74 Agente: **Carvajal y Urquijo, Isabel**

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

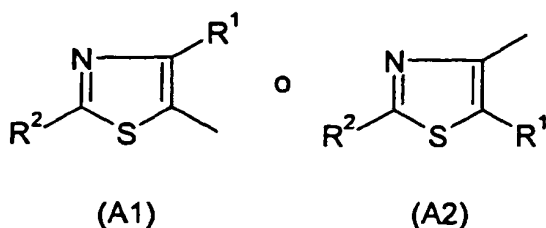
ANILIDAS DE ÁCIDOS TIAZOLCARBOXÍLICOS.**DESCRIPCIÓN.**

La presente invención se refiere a anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la
 5 fórmula I



en la que las variables tienen los significados siguientes:

A significa



- 10 X significa halógeno;
 Y significa ciano, nitro, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono,
 halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, metoxi o metiltio;
 p significa 0 o 1;
 R¹ significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o
 15 halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;
 R² significa hidrógeno, metilo o significa halógeno;
 R³ significa hidrógeno, metilo o etilo;
 W oxígeno o azufre.

En este caso, los substituyentes X pueden tener, independientemente entre sí,
 20 significados diferentes.

Por otra parte, la invención se refiere a procedimientos para llevar a cabo la
 obtención de estos compuestos, a los agentes que los contienen y a procedimientos
 para su empleo para la lucha contra los hongos dañinos.

- 2 -

Se conocen por la literatura anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos con efecto fungicida. De este modo, por ejemplo, la publicación EP-A 545 099 y la publicación EP-A 589 301 describen bifenilanilidas de este tipo, que presentan una monosustitución sobre el grupo bifenilo.

5 En la publicación WO 03/066609 se describen trifluórmetil-tiazolil-
carboxanilidas específicas y su efecto fungicida. Los compuestos descritos están
substituidos dos veces sobre el grupo bifenilo.

En la publicación WO 03/066610 se describen difluórmethyl-tiazolil-carboxanilidas específicas, que están monosustituidas o disustituidas sobre el

10 grupo bifenilo.

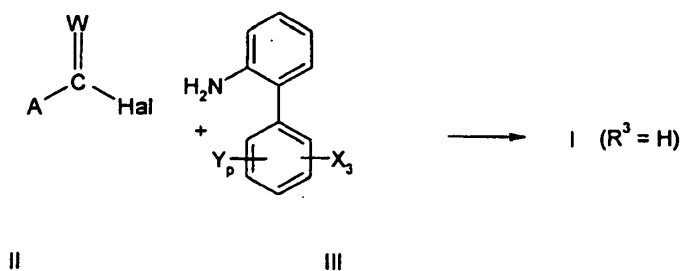
La tarea de la presente invención consistía en encontrar anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos con un efecto fungicida mejorado con comparación con el de los compuestos del estado de la técnica.

Por lo tanto, han sido encontrados los compuestos de la fórmula I, que han
15 sido definidos al principio.

Por otra parte, se encontraron procedimientos para llevar a cabo la obtención de estos compuestos, así como agentes que los contienen y procedimientos para su empleo en la lucha contra los hongos dañinos.

Los compuestos de la fórmula I pueden presentarse en diversas modificaciones cristalinas, que pueden diferenciarse en cuanto a su actividad biológica. Estas modificaciones constituyen de igual modo el objeto de la presente invención.

Se obtienen los compuestos I en general si se hace reaccionar un halogenuro de ácido carboxílico de la fórmula II, en forma en sí conocida (por ejemplo J. March, 25 Advanced Organic Chemistry, 2nd Ed., 382 f, McGraw-Hill, 1977) en presencia de una base, con una anilina de la fórmula III.



El resto Hal en la fórmula II significa un átomo de halógeno tal como flúor,

- 3 -

cloro, bromo y yodo, de manera especial significa flúor o cloro. Esta reacción se lleva a cabo de manera usual a temperaturas comprendidas entre (-20)°C hasta 100°C, de manera preferente comprendidas entre 0°C y 50°C.

Los disolventes adecuados son los hidrocarburos alifáticos tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano y el éter de petróleo, los hidrocarburos aromáticos tales como el tolueno, el o-xileno, el m-xileno y el p-xileno, los hidrocarburos halogenados tales como el cloruro de metileno, el cloroformo y el clorobenceno, los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el terc.-butilmetiléter, el dioxano, el anisol y el tetrahidrofurano, los nitrilos tales como el acetonitrilo y el propionitrilo, las cetonas tales como la acetona, la metiletilcetona, la dietilcetona y la terc.-butilmetilcetona, los alcoholes tales como el metanol, el etanol, el n-propanol, el isopropanol, el n-butanol y el terc.-butanol así como el cloruro de metileno, el dimetilsulfóxido y la dimetilformamida, de manera especialmente preferente el tolueno, el cloruro de metileno y el tetrahidrofurano.

De la misma manera, pueden ser empleadas mezclas de los disolventes citados.

A título de bases entran en consideración, en general, los compuestos inorgánicos tales como los hidróxidos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el hidróxido de litio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio y el hidróxido de calcio, los óxidos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el óxido de litio, el óxido de sodio, el óxido de calcio y el óxido de magnesio, los hidruros de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el hidruro de litio, el hidruro de sodio, el hidruro de potasio y el hidruro de calcio, las amidas de los metales alcalinos tales como la amida de litio, la amida de sodio y la amida de potasio, los carbonatos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el carbonato de litio y el carbonato de calcio así como los hidrógenocarbonatos de los metales alcalinos tal como el hidrógenocarbonato de sodio y los compuestos organometálicos, especialmente los alquilos de metales alcalinos tales como el metil-litio, el butil-litio y el fenil-litio, los halogenuros de alquilmagnesio tal como el cloruro de metilmagnesio así como los alcoholatos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el metanolato de sodio, el etanolato de sodio, el etanolato

- 4 -

de potasio, el terc.-butanolato de potasio y el dimetoximagnesio además bases orgánicas, por ejemplo las aminas terciarias tales como la trimetilamina, la trietilamina, la diisopropiletilamina y la N-metilpiperidina, la piridina, las piridinas sustituidas tales como la colidina, la lutidina y la 4-dimetilaminopiridina así como las aminas bicíclicas.

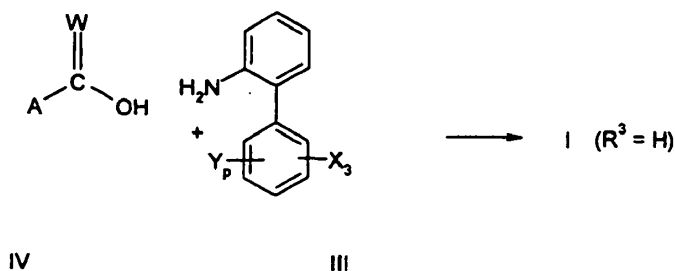
De manera especialmente preferente son empleadas la trietilamina y la piridina.

Las bases son empleadas, en general, en cantidades equimolares, con relación al compuesto II. Sin embargo, las bases también pueden ser empleadas en un exceso comprendido entre un 5 % en moles y un 30 % en moles, de manera preferente comprendido entre un 5 % en moles y un 10 % en moles o - en el caso en que se utilicen aminas terciarias - pueden ser empleadas en caso dado como disolventes.

En general se hacen reaccionar entre sí a los eductos en cantidades aproximadamente equimolares. Puede ser ventajoso para el rendimiento, emplear II en un exceso comprendido entre un 1 % en moles y un 20 % en moles, de manera 15 preferente comprendido entre un 1 % en moles y un 10 % en moles, referido a III.

Los productos de partida de las fórmulas II y III, que son necesarios para llevar a cabo la obtención de los compuestos I, son conocidos o pueden ser sintetizados de manera análoga a la de los compuestos conocidos (Helv. Chim. Acta 20 60, 978 (1977); Zh. Org. Khim. 26, 1527 (1990); Heterocycles 26, 1885 (1987); Izv. Akad. Nauk. SSSR Ser. Khim., 2160 (1982); THL 28, 593 (1987); THL 29, 5463 (1988)).

Por otra parte, se ha encontrado que los compuestos de la fórmula I se obtienen si se hacen reaccionar, de forma conocida, ácidos carboxílicos de la fórmula IV con una anilina de la fórmula III, en presencia de agentes deshidratantes y, en caso dado, en presencia de una base orgánica.



- 5 -

Los disolventes adecuados son los hidrocarburos alifáticos tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano y el éter de petróleo, los hidrocarburos aromáticos tales como el tolueno, el o-xileno, el m-xileno y el p-xileno, los hidrocarburos halogenados tales como el cloruro de metileno, el cloroformo y el clorobenceno, los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el terc.-butilmetiléter, el dioxano, el anisol y el tetrahidrofurano, los nitrilos tales como el acetonitrilo y el propionitrilo, las cetonas tales como la acetona, la metiletilcetona, la dietilcetona y la terc.-butilmetilcetona así como el dimetilsulfóxido y la dimetilformamida, siendo especialmente preferentes el cloruro de metileno, el tolueno y el tetrahidrofurano.

De igual modo pueden ser empleadas mezclas de los disolventes citados.

Como agentes deshidratantes entran en consideración, por ejemplo, el 1,1'-carbonildiimidazol, el cloruro de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosforilo, las carbodiimidas tales como la N,N'-diciclohexilcarbodiimida, la N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida, las sales de fosfonio tales como el hexaflúorfosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio, el hexaflúorfosfato de bromotripirrolidinofosfonio, el hexaflúorfosfato de bromotris(dimetilamino)fosfonio, el hexaflúorfosfato de clorotripinolidinofosfonio, las sales de uronio y de tiuronio tales como el hexaflúorfosfato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, el hexaflúorfosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, el hexaflúorfosfato de S-(1-óxido-2-piridil)-N,N,N',N'-tetramiltiuronio, el tetraflúorborato de O-(2-oxo-1(2H)piridil)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, el tetraflúorborato de O-[(etoxicarbonil)cianometilenamino]-N,N,N',N'-tetrametiluronio, las sales de carbenio tales como el hexaflúorfosfato de (benzotriazol-1-iloxi)dipirrolidinocarbenio, el hexaflúorfosfato de (benzotriazol-1-iloxi)dipiperidinocarbenio, el tetraflúorborato de O-(3,4-dihidro-4-oxo-1,2,3-benzotriazin-3-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, el tetraflúorborato de cloro-N',N'-bis(tetrametilen)formamidinio, el hexaflúorfosfato de clorodipirrolidinocarbenio, el tetraflúorborato de cloro-N,N,N',N'-bis(pentametilen)formamidinio, las sales de imidazolio tal como el tetraflúorborato de 2-cloro-1,3-dimetilimidazolidinio, de manera preferente el 1,1'-carbonildiimidazol, el cloruro de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosforilo, la N,N'-diciclohexilcarbodiimida y la N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida.

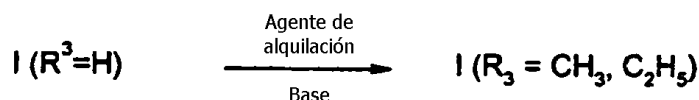
- 6 -

Como bases orgánicas entran en consideración, por ejemplo, las aminas terciarias tales como la trimetilamina, la trietilamina, la diisopropiletilamina y la N-metilpiperidina, la piridina, las piridinas substituidas tales como la colidina, la lutidina y la 4-dimetilaminopiridina así como las aminas bicíclicas. De manera especialmente preferente son empleadas la trietilamina y la piridina. Las bases son empleadas, en general, en un exceso comprendido entre un 10 % en moles y un 200 % en moles, de manera preferente comprendido entre un 50 % en moles y un 150 % en moles, referido al compuesto IV.

Los eductos se hacen reaccionar entre sí en general en cantidades aproximadamente equimolares. Puede ser ventajoso para el rendimiento emplear uno de los compuestos en un exceso comprendido entre un 1 % en moles y un 20 % en moles, de manera preferente comprendido entre un 1 % en moles y un 10 % en moles. Los agentes deshidratantes son empleados, en general, en un exceso comprendido entre un 5 % en moles y un 100 % en moles, de manera preferente comprendido entre un 5 % en moles y un 60 % en moles.

Los productos de partida de las fórmulas III y IV, que son necesarios para llevar a cabo la obtención de los compuestos I, son conocidos o pueden ser sintetizados de manera análoga a la de los compuestos conocidos.

Los compuestos I con $R^3 = CH_3$ o C_2H_5 se obtienen, de manera preferente, haciéndose reaccionar compuestos de la fórmula I con $R^3 = H$ de forma conocida en presencia de una base, con un agente de alquilación.



Los disolventes adecuados son los hidrocarburos alifáticos tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano y el éter de petróleo, los hidrocarburos aromáticos tales como el tolueno, el o-xileno, el m-xileno y el p-xileno, los hidrocarburos halogenados tales como el cloruro de metileno, el cloroformo y el clorobenceno, los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el terc.-butilmetiléter, el dioxano, el anisol y el tetrahydrofurano, así como el dimetilsulfóxido y la dimetilformamida, siendo especialmente preferentes el dietiléter, el terc.-butilmetiléter, el tetrahydrofurano y la dimetilformamida.

Así mismo pueden ser empleadas mezclas de los disolventes citados.

- 7 -

Los agentes de alquilación adecuados son, por ejemplo, los halogenuros de alquilo tales como el yoduro de metilo, el yoduro de etilo, el bromuro de metilo, el bromuro de etilo, el cloruro de metilo y el cloruro de etilo, los (perfluoralquilsulfonatos) de alquilo tales como el trifluormetilsulfonato de metilo y el trifluormetilsulfonato de etilo, los (alquilsulfonatos) de alquilo tales como el metilsulfonato de metilo y el metilsulfonato de etilo, los (arilsulfonatos) de alquilo tales como el p-tolilsulfonato de metilo y el p-tolilsulfonato de etilo, las sales de oxonio tales como el tetraflúorborato de trimetiloxonio y el tetraflúorborato de trietiloxonio.

10 Son especialmente preferentes el yoduro de metilo, el yoduro de etilo, el bromuro de metilo, el bromuro de etilo, el cloruro de metilo y el cloruro de etilo.

Como bases entran en consideración, en general, compuestos inorgánicos tales como los hidróxidos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el hidróxido de litio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio y el hidróxido de calcio, los óxidos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el óxido de litio, el óxido de sodio, el óxido de calcio y el óxido de magnesio, los hidruros de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el hidruro de litio, el hidruro de sodio, el hidruro de potasio y el hidruro de calcio, las amidas de los metales alcalinos tales como la amida de litio, la amida de sodio y la amida de potasio, los carbonatos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el carbonato de litio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio y el carbonato de calcio así como los hidrógenocarbonatos de los metales alcalinos tal como el hidrógenocarbonato de sodio, los compuestos organometálicos, de manera especial los alquilos de los metales alcalinos tales como el metil-litio, el butil-litio y el fenil-litio, los halogenuros de alquilmagnesio tal como el cloruro de metilmagnesio así como los alcoholatos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos tales como el metanolato de sodio, el etanolato de sodio, el etanolato de potasio y el terc.-butanolato de potasio.

30 De manera especialmente preferente son empleados el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidruro de sodio, el hidruro de potasio, el butil-litio y el terc.-butanolato de potasio.

- 8 -

Las bases son empleadas, en general, en cantidades aproximadamente equimolares, con respecto al compuesto I. Estas bases pueden ser empleadas también en un exceso comprendido entre un 5 % en moles y un 30 % en moles, de manera preferente comprendido entre un 5 % en moles y un 10 % en moles.

5 Los eductos se hacen reaccionar entre sí, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. Puede ser ventajoso para el rendimiento emplear el agente de alquilación en un exceso comprendido entre un 1 % en moles y un 20 % en moles, de manera preferente comprendido entre un 1 % en moles y un 10 % en moles, referido a I.

10 Los compuestos I, en los cuales X significa azufre, pueden ser obtenidos, por ejemplo, por medio de la sulfuración de los compuestos I correspondientes, en los cuales X signifique oxígeno (véase, por ejemplo, la publicación de los autores D. Petrova & K. Jakobcic, Croat. Chem. Acta 48, 49 (1976) así como la publicación WO 01/42223).

15 En lo que se refiere a su empleo en agentes fungicidas, entran en consideración aquellos compuestos de la fórmula I, en la que los substituyentes tienen el significado siguiente:

halógeno tal como flúor, cloro, bromo y yodo;

20 alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono tal como metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo y 1,1-dimetiletilo;

halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono significa un resto alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono parcial o completamente halogenado, siendo el/los átomos de halógeno(s) especialmente flúor, cloro y/o bromo, es decir por ejemplo clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, flúormetilo, diflúormetilo, triflúormetilo, cloroflúormetilo, 25 dicloroflúormetilo, clorodiflúormetilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-flúoretilo, 2-flúoretilo, 2,2-diflúoretilo, 2,2,2-triflúoretilo, 2-cloro-2-flúoretilo, 2-cloro-2,2-diflúoretilo, 2,2-dicloro-2-flúoretilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentaflúoretilo, heptaflúorpropilo o nonaflúorbutilo, de manera especial 30 significa halógenometilo, de manera especialmente preferente significa CH_2Cl , $\text{CH}(\text{Cl})_2$, CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CHFCl , CF_2Cl o $\text{CF}(\text{Cl})_2$.

En lo que se refiere al efecto biológico son especialmente preferentes aquellos

- 9 -

compuestos I, en los cuales las variables significan los restos siguientes:

- X significa F, Cl, de manera preferente significa flúor,
- Y significa alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, metoxi,
- 5 de manera preferente significa metilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, metoxi; de manera muy especialmente preferente significa metilo, trifluórmétilo;
- p significa 0, 1, de manera preferente significa 0;
- R¹ significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;
- 10 de manera preferente significa hidrógeno, F, Cl, metilo, fluórmétilo, difluórmétilo, clorofluórmétilo, clorodifluórmétilo, diclorofluórmétilo, trifluórmétilo;
- de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, fluórmétilo, difluórmétilo, clorofluórmétilo, trifluórmétilo; de manera especial significa difluórmétilo o trifluórmétilo;
- 15 R² significa hidrógeno, halógeno, metilo;
- de manera preferente significa hidrógeno, F, Cl, metilo;
- de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno, Cl o metilo;
- R³ significa hidrógeno o metilo; de manera preferente significa hidrógeno;
- 20 W significa oxígeno.

Son especialmente preferentes los compuestos I con las siguientes combinaciones de sustituyentes, en los cuales las variables tienen los significados siguientes:

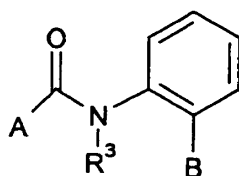
- X significa F o cloro;
- 25 Y significa metilo, difluórmétilo, trifluórmétilo o metoxi;
- p significa 0, 1;
- R¹ significa hidrógeno, F, Cl, metilo, fluórmétilo, difluórmétilo, clorofluórmétilo, clorodifluórmétilo, diclorofluórmétilo, trifluórmétilo;
- R² significa hidrógeno, F, Cl, metilo;
- 30 R³ significa hidrógeno o metilo;
- W significa oxígeno.

Por otra parte son preferentes también las siguientes combinaciones de las

- 10 -

variables con los significados siguientes:

- X significa F o cloro;
- p significa cero;
- R¹ significa hidrógeno, F, Cl, metilo, flúormetilo, diflúormetilo,
5 cloroflúormetilo, clorodiflúormetilo, dicloroflúormetilo o triflúormetilo;
- R² significa hidrógeno, F, Cl o metilo; de manera preferente significa hidrógeno,
 Cl o metilo;
- R³ significa hidrógeno;
- W significa oxígeno.
- 10 De manera especial son preferentes los compuestos de la fórmula general I-A
 desde el punto de vista de su aplicación como fungicidas.



(I-A)

Tabla A

Nr.	B	R ¹
1	2-Cloro-3,4-diflúorfenilo	CF ₃
2	2-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CF ₃
3	2-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CF ₃
4	2-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CF ₃
5	2-Cloro-3,6-diflúorfenilo	CF ₃
6	2-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CF ₃
7	3-Cloro-2,4-diflúorfenilo	CF ₃
8	3-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CF ₃
9	3-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CF ₃
10	3-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CF ₃

- 11 -

Nr.	B	R ¹
11	3-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CF ₃
12	3-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CF ₃
13	4-Cloro-2,3-diflúorfenilo	CF ₃
14	4-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CF ₃
15	4-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CF ₃
16	4-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CF ₃
17	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CF ₃
18	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CF ₃
19	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CF ₃
20	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CF ₃
21	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CF ₃
22	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CF ₃
23	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CF ₃
24	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CF ₃
25	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CF ₃
26	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CF ₃
27	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CF ₃
28	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CF ₃
29	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CF ₃
30	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CF ₃
31	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CF ₃
32	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CF ₃
33	2,3,4-Triclorofenilo	CHF ₂
34	2,3,5-Triclorofenilo	CHF ₂

- 12 -

Nr.	B	R ¹
35	2,3,6-Triclorofenilo	CHF ₂
36	2,4,5-Triclorofenilo	CHF ₂
37	2,4,6-Triclorofenilo	CHF ₂
38	3,4,5-Triclorofenilo	CHF ₂
39	2,3,4-Triflúorfenilo	CHF ₂
40	2,3,5-Triflúorfenilo	CHF ₂
41	2,3,6-Triflúorfenilo	CHF ₂
42	2,4,5-Triflúorfenilo	CHF ₂
43	2,4,6-Triflúorfenilo	CHF ₂
44	3,4,5-Triflúorfenilo	CHF ₂
45	2-Cloro-3,4-diflúorfenilo	CHF ₂
46	2-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CHF ₂
47	2-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CHF ₂
48	2-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CHF ₂
49	2-Cloro-3,6-diflúorfenilo	CHF ₂
50	2-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CHF ₂
51	3-Cloro-2,4-diflúorfenilo	CHF ₂
52	3-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CHF ₂
53	3-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CHF ₂
54	3-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CHF ₂
55	3-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CHF ₂
56	3-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CHF ₂
57	4-Cloro-2,3-diflúorfenilo	CHF ₂
58	4-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CHF ₂

- 13 -

Nr.	B	R ¹
59	4-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CHF ₂
60	4-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CHF ₂
61	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CHF ₂
62	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CHF ₂
63	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CHF ₂
64	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CHF ₂
65	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CHF ₂
66	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CHF ₂
67	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CHF ₂
68	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CHF ₂
69	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CHF ₂
70	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CHF ₂
71	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CHF ₂
72	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CHF ₂
73	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CHF ₂
74	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CHF ₂
75	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CHF ₂
76	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CHF ₂
77	2,3,4-Triclorofenilo	CH ₂ F
78	2,3,5-Triclorofenilo	CH ₂ F
79	2,3,6-Triclorofenilo	CH ₂ F
80	2,4,5-Triclorofenilo	CH ₂ F
81	2,4,6-Triclorofenilo	CH ₂ F
82	3,4,5-Triclorofenilo	CH ₂ F

- 14 -

Nr.	B	R ¹
83	2,3,4-Triflúorfenilo	CH ₂ F
84	2,3,5-Triflúorfenilo	CH ₂ F
85	2,3,6-Triflúorfenilo	CH ₂ F
86	2,4,5-Triflúorfenilo	CH ₂ F
87	2,4,6-Triflúorfenilo	CH ₂ F
88	3,4,5-Triflúorfenilo	CH ₂ F
89	2-Cloro-3,4-diflúorfenilo	CH ₂ F
90	2-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CH ₂ F
91	2-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
92	2-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CH ₂ F
93	2-Cloro-3,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
94	2-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
95	3-Cloro-2,4-diflúorfenilo	CH ₂ F
96	3-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CH ₂ F
97	3-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
98	3-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CH ₂ F
99	3-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
100	3-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
101	4-Cloro-2,3-diflúorfenilo	CH ₂ F
102	4-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CH ₂ F
103	4-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CH ₂ F
104	4-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CH ₂ F
105	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CH ₂ F
106	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CH ₂ F

- 15 -

Nr.	B	R ¹
107	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CH ₂ F
108	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CH ₂ F
109	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CH ₂ F
110	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CH ₂ F
111	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CH ₂ F
112	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CH ₂ F
113	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CH ₂ F
114	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CH ₂ F
115	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CH ₂ F
116	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CH ₂ F
117	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CH ₂ F
118	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CH ₂ F
119	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CH ₂ F
120	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CH ₂ F
121	2,3,4-Triclorofenilo	CHFCI
122	2,3,5-Triclorofenilo	CHFCI
123	2,3,6-Triclorofenilo	CHFCI
124	2,4,5-Triclorofenilo	CHFCI
125	2,4,6-Triclorofenilo	CHFCI
126	3,4,5-Triclorofenilo	CHFCI
127	2,3,4-Triflúorfenilo	CHFCI
128	2,3,5-Triflúorfenilo	CHFCI
129	2,3,6-Triflúorfenilo	CHFCI
130	2,4,5-Triflúorfenilo	CHFCI

- 16 -

Nr.	B	R ¹
131	2,4,6-Trifluórfenilo	CHFCI
132	3,4,5-Trifluórfenilo	CHFCI
133	2-Cloro-3,4-difluórfenilo	CHFCI
134	2-Cloro-4,5-difluórfenilo	CHFCI
135	2-Cloro-5,6-difluórfenilo	CHFCI
136	2-Cloro-3,5-difluórfenilo	CHFCI
137	2-Cloro-3,6-difluórfenilo	CHFCI
138	2-Cloro-4,6-difluórfenilo	CHFCI
139	3-Cloro-2,4-difluórfenilo	CHFCI
140	3-Cloro-2,5-difluórfenilo	CHFCI
141	3-Cloro-2,6-difluórfenilo	CHFCI
142	3-Cloro-4,5-difluórfenilo	CHFCI
143	3-Cloro-4,6-difluórfenilo	CHFCI
144	3-Cloro-5,6-difluórfenilo	CHFCI
145	4-Cloro-2,3-difluórfenilo	CHFCI
146	4-Cloro-2,5-difluórfenilo	CHFCI
147	4-Cloro-2,6-difluórfenilo	CHFCI
148	4-Cloro-3,5-difluórfenilo	CHFCI
149	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CHFCI
150	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CHFCI
151	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CHFCI
152	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CHFCI
153	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CHFCI
154	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CHFCI

- 17 -

Nr.	B	R ¹
155	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CHFCl
156	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CHFCl
157	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CHFCl
158	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CHFCl
159	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CHFCl
160	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CHFCl
161	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CHFCl
162	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CHFCl
163	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CHFCl
164	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CHFCl
165	2,3,4-Triclorofenilo	CF ₂ Cl
166	2,3,5-Triclorofenilo	CF ₂ Cl
167	2,3,6-Triclorofenilo	CF ₂ Cl
168	2,4,5-Triclorofenilo	CF ₂ Cl
169	2,4,6-Triclorofenilo	CF ₂ Cl
170	3,4,5-Triclorofenilo	CF ₂ Cl
171	2,3,4-Triflúorfenilo	CF ₂ Cl
172	2,3,5-Triflúorfenilo	CF ₂ Cl
173	2, 3,6-Triflúorfenilo	CF ₂ Cl
174	2,4,5-Triflúorfenilo	CF ₂ Cl
175	2,4,6-Triflúorfenilo	CF ₂ Cl
176	3,4,5-Triflúorfenilo	CF ₂ Cl
177	2-Cloro-3,4-diflúorfenilo	CF ₂ Cl
178	2-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CF ₂ Cl

- 18 -

Nr.	B	R ¹
179	2-Cloro-5,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
180	2-Cloro-3,5-difluórfenilo	CF ₂ Cl
181	2-Cloro-3,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
182	2-Cloro-4,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
183	3-Cloro-2,4-difluórfenilo	CF ₂ Cl
184	3-Cloro-2,5-difluórfenilo	CF ₂ Cl
185	3-Cloro-2,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
186	3-Cloro-4,5-difluórfenilo	CF ₂ Cl
187	3-Cloro-4,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
188	3-Cloro-5,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
189	4-Cloro-2,3-difluórfenilo	CF ₂ Cl
190	4-Cloro-2,5-difluórfenilo	CF ₂ Cl
191	4-Cloro-2,6-difluórfenilo	CF ₂ Cl
192	4-Cloro-3,5-difluórfenilo	CF ₂ Cl
193	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CF ₂ Cl
194	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CF ₂ Cl
195	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
196	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CF ₂ Cl
197	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
198	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
199	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CF ₂ Cl
200	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CF ₂ Cl
201	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
202	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CF ₂ Cl

- 19 -

Nr.	B	R ¹
203	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
204	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
205	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CF ₂ Cl
206	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CF ₂ Cl
207	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CF ₂ Cl
208	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CF ₂ Cl
209	2,3,4-Triclorofenilo	CFCl ₂
210	2,3,5-Triclorofenilo	CFCl ₂
211	2,3,6-Triclorofenilo	CFCl ₂
212	2,4,5-Triclorofenilo	CFCl ₂
213	2,4,6-Triclorofenilo	CFCl ₂
214	3,4,5-Triclorofenilo	CFCl ₂
215	2,3,4-Triflúorfenilo	CFCl ₂
216	2,3,5-Triflúorfenilo	CFCl ₂
217	2,3,6-Triflúorfenilo	CFCl ₂
218	2,4,5-Triflúorfenilo	CFCl ₂
219	2,4,6-Triflúorfenilo	CFCl ₂
220	3,4,5-Triflúorfenilo	CFCl ₂
221	2-Cloro-3,4-diflúorfenilo	CFCl ₂
222	2-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CFCl ₂
223	2-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CFCl ₂
224	2-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CFCl ₂
225	2-Cloro-3,6-diflúorfenilo	CFCl ₂
226	2-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CFCl ₂

- 20 -

Nr.	B	R ¹
227	3-Cloro-2,4-diflúorfenilo	CFCl ₂
228	3-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CFCl ₂
229	3-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CFCl ₂
230	3-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CFCl ₂
231	3-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CFCl ₂
232	3-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CFCl ₂
233	4-Cloro-2,3-diflúorfenilo	CFCl ₂
234	4-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CFCl ₂
235	4-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CFCl ₂
236	4-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CFCl ₂
237	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CFCl ₂
238	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CFCl ₂
239	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CHFCl ₂
240	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CFCl ₂
241	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CFCl ₂
242	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CFCl ₂
243	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CFCl ₂
244	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CHFCl ₂
245	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CFCl ₂
246	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CHFCl ₂
247	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CFCl ₂
248	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CFCl ₂
249	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CFCl ₂
250	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CFCl ₂

- 21 -

Nr.	B	R ¹
251	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CFCl ₂
252	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CFCl ₂
253	2,3,4-Triclorofenilo	CH ₃
254	2,3,5-Triclorofenilo	CH ₃
255	2,3,6-Triclorofenilo	CH ₃
256	2,4,5-Triclorofenilo	CH ₃
257	2,4,6-Triclorofenilo	CH ₃
258	3,4,5-Triclorofenilo	CH ₃
259	2,3,4-Triflúorfenilo	CH ₃
260	2,3,5-Triflúorfenilo	CH ₃
261	2,3,6-Triflúorfenilo	CH ₃
262	2,4,5-Triflúorfenilo	CH ₃
263	2,4,6-Triflúorfenilo	CH ₃
264	3,4,5-Triflúorfenilo	CH ₃
265	2-Cloro-3,4-diflúorfenilo	CH ₃
266	2-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CH ₃
267	2-Cloro-5,6-diflúorfenilo	CH ₃
268	2-Cloro-3,5-diflúorfenilo	CH ₃
269	2-Cloro-3,6-diflúorfenilo	CH ₃
270	2-Cloro-4,6-diflúorfenilo	CH ₃
271	3-Cloro-2,4-diflúorfenilo	CH ₃
272	3-Cloro-2,5-diflúorfenilo	CH ₃
273	3-Cloro-2,6-diflúorfenilo	CH ₃
274	3-Cloro-4,5-diflúorfenilo	CH ₃

Nr.	B	R ¹
275	3-Cloro-4,6-difluórfenilo	CH ₃
276	3-Cloro-5,6-difluórfenilo	CH ₃
277	4-Cloro-2,3-difluórfenilo	CH ₃
278	4-Cloro-2,5-difluórfenilo	CH ₃
279	4-Cloro-2,6-difluórfenilo	CH ₃
280	4-Cloro-3,5-difluórfenilo	CH ₃
281	2-Flúor-3,4-diclorofenilo	CH ₃
282	2-Flúor-4,5-diclorofenilo	CH ₃
283	2-Flúor-5,6-diclorofenilo	CH ₃
284	2-Flúor-3,5-diclorofenilo	CH ₃
285	2-Flúor-3,6-diclorofenilo	CH ₃
286	2-Flúor-4,6-diclorofenilo	CH ₃
287	3-Flúor-2,4-diclorofenilo	CH ₃
288	3-Flúor-2,5-diclorofenilo	CH ₃
289	3-Flúor-2,6-diclorofenilo	CH ₃
290	3-Flúor-4,5-diclorofenilo	CH ₃
291	3-Flúor-4,6-diclorofenilo	CH ₃
292	3-Flúor-5,6-diclorofenilo	CH ₃
293	4-Flúor-2,3-diclorofenilo	CH ₃
294	4-Flúor-2,5-diclorofenilo	CH ₃
295	4-Flúor-2,6-diclorofenilo	CH ₃
296	4-Flúor-3,5-diclorofenilo	CH ₃

Tabla 1:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R², R³

- 23 -

significan hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 2:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa metilo, R^3 significa hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 3:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa Cl, R^3 significa hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 4:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa F, R^3 significa hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 5:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa hidrógeno, R^3 significa metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 6:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 , R^3 significa metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 7:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa Cl, R^3 significa metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 8:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa F, R^3 significa metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 9:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa

- 24 -

hidrógeno, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 10:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa metilo, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 11:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa Cl, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 12:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A1, R^2 significa F, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 13:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 , R^3 significan hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 14:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa metilo, R^3 significa hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 15:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa Cl, R^3 significa hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 16:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa F, R^3 significa hidrógeno y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 17:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa

- 25 -

hidrógeno, R^3 significa metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 18:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 , R^3 significan metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 19:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa Cl, R^3 significa metilo y R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 20:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa F, R^3 significa metilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 21:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa hidrógeno, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 22:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa metilo, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 23:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa Cl, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Tabla 24:

Compuestos de la fórmula general I-A, en la que A significa A2, R^2 significa F, R^3 significa etilo y correspondiendo R^1 y B para cada compuesto individual respectivamente a una línea de la tabla A.

Son muy especialmente preferentes las siguientes anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I:

- 26 -

la N-(3',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2-metil-4-trifluormetiltiazol-5-carboxílico,

la N-(2',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2-metil-4-trifluormetiltiazol-5-carboxílico,

5 la N-(3',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2,4-dimetiltiazol-5-carboxílico y

la N-(2',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2,4-dimetiltiazol-5-carboxílico.

Los compuestos I son adecuados como fungicidas. Éstos se caracterizan por
 10 una excelente actividad contra un amplio espectro de hongos patógenos para las plantas, especialmente de la clase de los *Ascomyceten*, de los *Deuteromyceten*, de los *Oomyceten* y de los *Basidiomyceten*. Estos compuestos son en parte sistémicamente activos y pueden ser empleados en la protección de las plantas como fungicidas de las hojas, desinfectantes y como fungicidas para el terreno.

15 Estos compuestos tienen un significado especial para la lucha contra una pluralidad de hongos en diversas plantas de cultivo tales como el trigo, el centeno, la cebada, la avena, el arroz, el maíz, el pasto, las plataneras, el algodón, la soja, el café, la caña de azúcar, la vid, las plantas frutales y las plantas ornamentales y las verduras y hortalizas tales como los pepinos, las judías, los tomates, las patatas y los cultivos
 20 de cucurbitáceas, así como sobre las semillas de estas plantas.

De manera especial los compuestos son adecuados para la lucha contra las siguientes enfermedades de las plantas:

- especies de *Alternaria* en verduras y hortalizas , colza, remolacha azucarera y frutas y arroz, tal como, por ejemplo, *A. solani* o *A. alternata* en patatas y
 25 tomates,
- especies de *Aphanomyces* en remolacha azucarera y verduras y hortalizas,
- especies de *Ascochyta* en cereales y verduras y hortalizas,
- especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en maíz, cereales, arroz y césped, por ejemplo *D. maydis* en maíz,
- 30 • *Blumeria graminis* (mildíu real) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, verduras y hortalizas, flores y cepas,
- *Bremia lactucae* en lechuga,

- 27 -

- especies de *Cercospora* en maíz, frijoles de soja, arroz y remolacha azucarera,
- especies de *Cochliobolus* en maíz, cereales, arroz, por ejemplo *Cochliobolus sativus* en cereales, *Cochliobolus miyabeanus* en arroz,
- especies de *Colletotricum* en frijoles de soja y algodón,
- 5 • especies de *Drechslera*, especies de *Pyrenophora* en maíz, cereales, arroz y césped, por ejemplo *D. teres* en cereales o *D. tritici-repentis* en trigo,
- *Esca* en cepas, provocada por *Phaeoacremonium chlamydosporium*, *Ph. Aleophilum*, y *Formitipora punctata* (sinónimo *Phellinis punctatus*),
- especies de *Exserohilum* en maíz,
- 10 • *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cultivos de pepinos,
- especies de *Fusarium* y *Verticillium* en diversas plantas, por ejemplo *F. graminearum* o *F. culmorum* en cereales o *F. oxysporum* en una pluralidad de plantas, por ejemplo en tomates,
- *Gaeumanomyces graminis* en cereales,
- 15 • especies de *Gibberella* en cereales y arroz (por ejemplo *Gibberella fujikuroi* en arroz),
- *Grainstaining complex* en arroz,
- especies de *Helminthosporium* en maíz y arroz,
- *Michrodochium nivale* en cereales,
- 20 • especies de *Mycosphaerella* en cereales, plataneras y cacahuetes, por ejemplo *M. graminicola* en trigo o *M. fijiensis* en plataneras,
- especies de *Peronospora* en col y en cultivos de bulbo, por ejemplo *P. brassicae* en col o *P. destructor* en cebolla,
- *Phakopsara pachyrhizi* y *Phakopsara meibomiae* en frijoles de soja,
- 25 • especies de *Phomopsis* en frijoles de soja y girasol,
- *Phytophthora infestans* en patatas y tomates,
- especies de *Phytophthora* en diversas plantas, por ejemplo *P. capsici* en pimientos,
- *Plasmopara viticola* en cepas,
- 30 • *Podosphaera leucotricha* en manzanos,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en cereales,

- 28 -

- *Pseudoperonospora* en diversas plantas tal como, por ejemplo *P. cubensis* en pepino o *P. humili* en lúpulo,
- especies de *Puccinia* en diversas plantas, por ejemplo *P. triticina*, *P. striiformis*, *P. hordei* o *P. graminis* en cereales, o *P. asparagi* en espárragos,
- 5 • *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae* en arroz,
- *Pyricularia grisea* en césped y cereales,
- *Pythium spp.* en césped, arroz, maíz, algodón, colza, girasol, remolacha azucarera, verduras y hortalizas y otras plantas, por ejemplo *P. ultimum* en
- 10 diversas plantas, *P. aphanidermatum* en césped,
- especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz, patatas, césped, maíz, colza, remolacha azucarera, verduras y hortalizas y en diversas plantas, por ejemplo *R. solani* en remolacha y diversas plantas,
- *Rhynchosporium secalis* en cereales, centeno y triticale,
- 15 • especies de *Sclerotinia* en colza y girasol,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- *Erysiphe* (sinónimo *Uncinula*) *necator* en cepas,
- especies de *Setosphaeria* en maíz y césped,
- *Sphacelotheca reilina* en maíz,
- 20 • especies de *Thievaliopsis* en frijoles de soja y algodón,
- especies de *Tilletia* en cereales,
- especies de *Ustilago* en cereales, maíz y remolacha azucarera, por ejemplo *U. maydis* en maíz,
- especies de *Venturia* (antracnosis) en manzanos y perales, por ejemplo *V. inaequalis* en manzano.
- 25

Los compuestos de la fórmula I son adecuados, de manera especial, para la lucha contra los hongos dañinos de la clase de los Peronosporomycetes (sinónimo Oomycetes), tales como las especies de Peronospora, las especies de Phytophthora, Plasmopara viticola, las especies de Pseudoperonospora y las especies de Pythium.

- 30 De igual modo, los compuestos I son adecuados para la lucha contra los hongos dañinos en la protección de los materiales (por ejemplo de la madera, del papel, de las dispersiones para la pintura, de las fibras o bien de los tejidos) y en la

- 29 -

protección de los artículos almacenados. En la protección de la madera encuentran consideración, de manera especial, los hongos dañinos siguientes: los Ascomycetes tales como *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma spp.*, *Chaetomium spp.*, *Humicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*;
 5 los Basidiomycetes tales como *Coniophora spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Lentinus spp.*, *Pleurotus spp.*, *Poria spp.*, *Serpula spp.* y *Tyromyces spp.*, los Deuteromycetes tales como *Aspergillus spp.*, *Cladosporium spp.*, *Penicillium spp.*, *Trichoderma spp.*, *Alternaria spp.*, *Paecilomyces spp.* y los Zygomycetes tales como *Mucor spp.*, además, en la protección de los materiales, los siguientes hongos de
 10 levadura: *Candida spp.* y *Saccharomyces cerevisae*.

Los compuestos I son empleados por medio del tratamiento de los hongos o de las plantas, de las semillas, de los materiales o de los terrenos, que deben ser protegidos contra al ataque fúngico, con una cantidad fungicidamente activa de los productos activos. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes así como, también,
 15 después de la infección de los materiales, de las plantas o de las semillas por parte de los hongos.

Los agentes fungicidas contienen, en general, desde un 0,1 hasta un 95, de manera preferente desde un 0,5 hasta un 90 % en peso de producto activo.

Las cantidades de aplicación se encuentran comprendidas, en el caso de la
 20 aplicación destinada a la protección de las plantas, de conformidad con el tipo del efecto deseado, entre 0,01 y 2,0 kg de producto activo por ha.

En el caso del tratamiento de las semillas se requieren, en general, cantidades del producto activo comprendidas entre 1 y 1.000 g/100 kg, de manera preferente comprendidas entre 5 y 100 g/100 kg de semillas.

25 En el caso de la aplicación destinada a la protección de los materiales y de los artículos almacenados, la cantidad de aplicación de producto activo depende del tipo del campo de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades de aplicación usuales, en el caso de la protección de los materiales, se encuentran comprendidas, por ejemplo, entre 0,001 g y 2 kg, de manera preferente, las cantidades de aplicación se
 30 encuentran comprendidas entre 0,005 g y 1 kg de producto activo por metro cúbico de material a ser tratado.

Los compuestos I pueden transformarse en formulaciones usuales, por

- 30 -

ejemplo en soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos finos, polvos, pastas y granulados. La forma de aplicación depende de la correspondiente finalidad de utilización; en cualquier caso debe garantizar una distribución fina y uniforme del compuesto de conformidad con la invención.

5 Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo por dilución del producto activo con disolventes y/o con productos de soporte, en caso deseado con empleo de emulsionantes y de agentes dispersantes. Como disolventes / productos auxiliares entran en consideración esencialmente, para esta finalidad:

- El agua, los disolventes aromáticos (por ejemplo productos de Solvesso®, el
10 xileno), las parafinas (por ejemplo las fracciones de petróleo), los alcoholes (por ejemplo el metanol, el butanol, el pentanol, el alcohol bencílico), las cetonas (por ejemplo la ciclohexanona, la gama-butirolactona), las pirrolidonas (la N-metil-pirrolidona, la N-octilpirrolidona), los acetatos (el diacetato de glicol), los glicoles, las dimetilamidas de los ácidos grasos, los
15 ácidos grasos y los ésteres de ácidos grasos. Básicamente, pueden emplearse también mezclas de disolventes.
- Los productos de soporte tales como las harinas minerales naturales (por ejemplo los caolines, las arcillas, el talco, la creta) y las harinas minerales sintéticas (por ejemplo el ácido silícico altamente dispersado, los silicatos);
20 los agentes emulsionantes tales como los emulsionantes no ionógenos y aniónicos (por ejemplo los éteres de polioxietileno-alcoholes grasos, los sulfonatos de alquilo y los sulfonatos de arilo) y agentes dispersantes como lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

Como productos tensioactivos son empleadas las sales alcalinas,
25 alcalinotérreas, de amonio del ácido ligninsulfónico, del ácido naftalinsulfónico, del ácido fenolsulfónico, del ácido dibutilnaftalinsulfónico, los sulfonatos de alquilarilo, los sulfatos de alquilo, los sulfonatos de alquilo, los sulfatos de alcoholes grasos, los ácidos grasos y los glicoléteres de alcoholes grasos sulfatados, así mismo, entran en consideración los productos de condensación con formaldehído de la naftalina
30 sulfonada y de los derivados de la naftalina sulfonados, los productos de condensación de la naftalina o bien del ácido naftalinsulfónico con fenol y con formaldehído, los polioxietilenoctilfenoléteres, el isoocetilfenol etoxilado, el

- 31 -

octilfenol etoxilado, el nonilfenol etoxilado, los alquilfenolpoliglicoléteres, los tributilfenilpoliglicoléteres, los triestearilfenilpoliglicoléteres, los alquilarilpoliéteralcoholes, los condensados de alcoholes y de alcoholes grasos con óxido de etileno, el aceite de ricino etoxilado, los polioxietilentalquiléteres, el polioxipropileno etoxilado, el acetal del laurilalcoholpoliglicoléter, los ésteres de sorbita, las lejías sulfúicas de lignina y la metilcelulosa.

Para la obtención de las soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleaginosas, directamente pulverizables, entran en consideración las fracciones de los aceites minerales con un punto de ebullición medio hasta elevado, tales como la querosina o el aceite diesel, así mismo, los aceites de alquitrán de carbón así como los aceites de origen vegetal o animal, los hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, tales como, por ejemplo, el tolueno, el xileno, la parafina, la tetrahidronaftalina, las naftalinas alquiladas o sus derivados, el metanol, el etanol, el propanol, el butanol, el ciclohexanol, la ciclohexanona, la isoforona, los disolventes polares fuertes, por ejemplo el dimetilsulfóxido, la N-metilpirrolidona o el agua.

Los agentes para ser espolvoreados, para ser esparcidos y para ser pulverizados pueden ser preparados por mezcla o por molienda conjunta de las sustancias activas con un producto de soporte sólido.

Los granulados, por ejemplo los granulados revestidos, impregnados y homogéneos, pueden fabricarse por medio de una aglutinación de los productos activos sobre productos de soporte sólidos. Los productos de soporte sólidos son, por ejemplo, las tierras minerales, tales como los geles de sílice, los silicatos, el talco, el caolín, el Attaclay, la piedra caliza, la cal, la creta, los bolus, los loes, la arcilla, la dolomita, la tierra de diatomeas, el sulfato de calcio y el sulfato de magnesio, el óxido de magnesio, los materiales sintéticos molidos, los abonos, tales como, por ejemplo, el sulfato de amonio, el fosfato de amonio, el nitrato de amonio, la urea y los productos vegetales, tales como las harinas de cereales, las harinas de cortezas de árboles, el serrín de madera y el serrín de cáscaras de nueces, el polvo de celulosa y otros productos de soporte sólidos.

Las formulaciones contienen, en general, desde un 0,01 hasta un 95 % en peso, de manera preferente contienen desde un 0,1 hasta un 90 % en peso de, al menos, un producto activo I. Los productos activos son empleados, en este caso, con

- 32 -

una pureza comprendida entre un 90 % y un 100 %, de manera preferente comprendida entre un 95 % y un 100 % (de conformidad con el espectro de RMN).

Ejemplos de formulaciones son: 1. Productos para la dilución con agua

A Concentrados solubles en agua (SL, LS)

5 Se disuelven 10 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención con 90 partes en peso de agua o de un disolvente soluble en agua. De forma alternativa, se añaden agentes humectantes u otros agentes auxiliares. Por medio de la dilución en agua se disuelve el producto activo. De este modo, se obtiene una formulación con un contenido en producto activo del 10 % en peso.

B Concentrados dispersables (DC)

15 Se disuelven 20 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un agente dispersante, por ejemplo la polivinilpirrolidona. Por medio de una dilución en agua se produce una dispersión. El contenido en producto activo es del 20 % en peso

C Concentrados emulsionables (EC)

20 Se disuelven 15 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención en 75 partes en peso de xileno con adición de dodecylbencenosulfonato de Ca y de etoxilato de aceite de ricino (respectivamente 5 partes en peso). Por medio de la dilución en agua se produce una emulsión. La formulación tiene un contenido en producto activo del 15 % en peso.

D Emulsiones (EW, EO, ES)

25 Se disuelven 25 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecylbencenosulfonato de Ca y de etoxilato de aceite de ricino (respectivamente 5 partes en peso). Esta mezcla se incorpora en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsionadora (Ultraturrax) y se lleva hasta una emulsión homogénea. Por medio de la dilución en agua se produce una emulsión. La formulación tiene un contenido en producto activo del 25 % en peso.

- 33 -

E Suspensiones (SC, OD, FS)

Se desmenuzan 20 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención, por medio de la adición de 10 partes en peso de agentes dispersantes y humectantes y de 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico, en un molino de bolas, con agitador, para dar una suspensión fina del producto activo. Por medio de la dilución en agua se produce una suspensión estable del producto activo. El contenido en producto activo en la formulación es del 20 % en peso.

F Granulados dispersables en agua y solubles en agua (WG, SG)

Se muelen finamente 50 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención con adición de 50 partes en peso de agentes dispersantes y de agentes humectantes y se prepara, por medio de dispositivos industriales (por ejemplo por extrusión, en una torre de pulverización, en un lecho fluidizado) como granulados dispersables en agua o solubles en agua. Por medio de la dilución en agua se produce una dispersión estable o una solución estable del producto activo. La formulación tiene un contenido en producto activo del 50 % en peso.

G Polvos dispersables en agua y solubles en agua (WP, SP, SS, WS)

Se muelen 75 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención con adición de 25 partes en peso de agentes dispersantes y de agentes humectantes así como de gel de ácido silícico, en un molino de rotor-estator. Por medio de la dilución en agua se produce una dispersión estable o una solución estable del producto activo. El contenido en producto activo de la formulación es del 75 % en peso.

H Formulaciones en forma de gel (GF)

Se molieron en un molino de bolas 20 partes en peso de un compuesto I de conformidad con la invención, 10 partes en peso de agentes dispersante, 1 parte en peso de agente de hinchamiento (“gelling agent”) y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico para formar una suspensión fina. Por medio de la dilución en agua se produce una dispersión estable con un contenido en producto activo del 20 % en peso

2. Productos para la aplicación directa

J Polvos (DP, DS)

Se muelen finamente 5 partes en peso de compuesto I de conformidad con la invención y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. De este modo se obtiene un agente espolvoreable con un contenido en producto activo del 5 % en peso.

K Granulados (GR, FG, GG, MG)

Se muelen finamente 0,5 partes en peso de compuesto I de conformidad con la invención y se combinan con 99,5 partes en peso de productos de soporte. Los procedimientos usuales en este caso son la extrusión, el secado por pulverización o el lecho fluidizado. De este modo se obtiene un granulado para la aplicación directa con un contenido en producto activo del 0,5 % en peso.

L Soluciones de volumen ultra bajo ULV (UL)

Se disuelven 10 partes en peso de compuesto I de conformidad con la invención en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo el xileno. De este modo se obtiene un producto para la aplicación directa con un contenido en producto activo del 10 % en peso.

Para el tratamiento de las semillas se emplearán, de manera usual, los concentrados solubles en agua (LS), las suspensiones (FS), los polvos finos (DS), los polvos dispersables en agua y solubles en agua (WS, SS), las emulsiones (ES), los concentrados emulsionables (EC) y las formulaciones en estado de gel (GF). Estas formulaciones pueden aplicarse sobre las semillas en estado no diluido o, de manera preferente, en estado diluido. La aplicación puede llevarse a cabo como paso previo a la siembra.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas, por ejemplo en forma de soluciones, de polvos, de suspensiones o de dispersiones directamente pulverizables, de emulsiones, de dispersiones oleaginosas, de pastas, de agentes espolvoreables, de agentes esparcibles, de granulados, por medio de una aspersión, de una nebulización, de un espolvoreado, de un esparcido o por riego. Las formas de aplicación dependen totalmente de las finalidades de la aplicación; en cualquier caso deben garantizar una distribución tan fina como sea posible de los

- 35 -

productos activos I de conformidad con la invención.

Las formas de aplicación acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, de pastas o de polvos humectables (polvos inyectables, dispersiones oleaginosas), por medio de la adición de agua. Para la obtención de emulsiones, de
5 pastas o de dispersiones oleaginosas pueden homogenizarse en agua las sustancias, como tales, o disueltas en un aceite o en un disolvente, por medio de agentes humectantes, taquificantes, dispersantes o emulsionantes. No obstante, pueden prepararse, también, concentrados constituidos por la sustancia activa, por los
10 agentes humectantes, taquificantes, dispersantes o emulsionantes y, eventualmente, por el disolvente o el aceite, cuyos concentrados sean adecuados para la dilución con agua.

Las concentraciones de producto activo en las preparaciones listas para su aplicación pueden variar dentro de amplios límites. En general, se encuentran comprendidas entre un 0,0001 y un 10 %, preferentemente se encuentran
15 comprendidas entre un 0,01 y un 1 %.

Los productos activos pueden emplearse también con un buen éxito en los procedimientos de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones con más de un 95 % en peso de producto activo o incluso siendo posible aplicar el
producto activo sin aditivos.

20 A los productos activos se les pueden añadir aceites de diversos tipos, agentes humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros agentes para la lucha contra las plagas, bactericidas, en caso dado incluso inmediatamente antes de la aplicación (mezcla de tanque). Estos agentes pueden añadirse a los agentes de conformidad con la invención, de manera usual, en la proporción en peso comprendida entre 1:100 y
25 100:1, de manera preferente comprendida entre 1:10 y 10:1.

Como adyuvantes en este sentido entran en consideración, de manera especial: los polisiloxanos modificados de manera orgánica, por ejemplo Break Thru S 240[®]; los alcoholalcoxilatos, por ejemplo Atplus 245[®], Atplus MBA 1303[®], Plurafac[®] LF 300 y Lutensol[®] ON 30; polímeros bloque de EO-PO, por ejemplo
30 Pluronic[®] RPE 2035 y Genapol[®] B; alcoholetoxilatos, por ejemplo Lutensol[®] XP80; y el dioctilsulfosuccinato de sodio, por ejemplo Leophen[®] RA.

Los agentes, de conformidad con la invención, pueden presentarse en la

- 36 -

forma de aplicación como fungicidas, también, junto con otros productos activos, por ejemplo con herbicidas, insecticidas, reguladores del crecimiento, tal como Prohexadion Ca, fungicidas o, incluso, con abonos. Cuando se mezclan los compuestos I, o bien los agentes que los contienen, con uno o con varios productos
 5 activos más, de manera especial con fungicidas, puede modificarse en muchos casos el espectro de actividad o pueden combatirse desarrollos de resistencia. En muchos casos se obtienen, de este modo, efectos sinérgicos.

La lista siguiente de fungicidas, con los que pueden ser empleados conjuntamente los compuestos, de conformidad con la invención, sirve para explicar
 10 las posibilidades de combinación, sin que esto sea limitativo:

Estrobilurinas

Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Enestroburin, Fluoxastrobin, Kresoxim-metilo, Metominostrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin, Trifloxystrobin, Orysastrobin, el éster de metilo del ácido (2-cloro-5-[1-(3-metil-benciloxiimino)-etil]-bencil)-
 15 carbámico, el éster de metilo del ácido (2-cloro-5-[1-(6-metil-piridin-2-ilmetoxiimino)-etil]-bencil)-carbámico, el éster de metilo del ácido 2-(orto-(2,5-dimetilfenil-oximetilen)fenil)-3-metoxi-acrílico;

Amidas de ácidos carboxílicos

- anilidas de ácidos carboxílicos: Benalaxyl, Benodanil, Boscalid, Carboxin,
 20 Mepronil, Fenfuram, Fenhexamid, Flutolanil, Furametpyr, Metalaxil, Ofurace, Oxadixyl, Oxycarboxin, Penthiopyrad, Thifluzamide, Thiadinil, la (4'-bromo-bifenil-2-il)-amida del ácido 4-difluórmethyl-2-metil-tiazol-5-carboxílico, la (4'-trifluórmethyl-bifenil-2-il)-amida del ácido 4-difluórmethyl-2-metil-tiazol-5-carboxílico, la (4'-cloro-3'-flúor-bifenil-2-il)-amida del ácido 4-difluórmethyl-2-metil-tiazol-5-carboxílico, la (3',4'-dicloro-4-flúor-bifenil-2-il)-
 25 amida del ácido 3-difluórmethyl-1-metil-pirazol-4-carboxílico, la (2-ciano-fenil)-amida del ácido 3,4-dicloro-isotiazol-5-carboxílico;
- morfoluros de ácidos carboxílicos: Dimethomorph, Flumorph;
- amidas del ácido benzoico: Flumetover, Fluopicolid (Picobenzamid),
 30 Zoxamid;
- otras amidas de ácidos carboxílicos: Carpropamid, Diclocymet, Mandipropamid, la N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenil)-

- 37 -

etil)-2-metanosulfonilamino-3-metil-butiramida, la N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-inilo]-3-metoxi-fenil)-etil)-2-etanosulfonilamino-3-metil-butiramida;

Azoles

- 5 • triazoles: Bitertanol, Bromuconazol, Cyproconazol, Difenoconazol, Diniconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Flusilazol, Fluquinconazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imibenconazol, Ipconazol, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prothioconazol, Simeconazol, Tebuconazol, Tetraconazol, Triadimenol, Triadimefon,
- 10 Triticonazol;
- imidazoles: Cyazofamid, Imazalil, Pefurazoat, Prochloraz, Triflumizol;
 - bencimidazoles: Benomyl, Carbendazim, Fuberidazol, Thiabendazol;
 - otros: Ethaboxam, Etridiazol, Hymexazol;

Compuestos heterocíclicos nitrogenados

- 15 • piridinas: Fluazinam, Pyrifenox, la 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina;
- pirimidinas: Bupirimate, Cyprodinil, Ferimzone, Fenarimol, Mepanipyrim, Nuarimol, Pyrimethanil;
 - piperazinas: Triforine;
- 20 • pirroles: Fludioxonil, Fenpiclonil;
- morfolinas: Aldimorph, Dodemorph, Fenpropimorph, Tridemorph;
 - dicarboximidas: Iprodion, Procymidon, Vinclozolin;
 - otros: Acibenzolar-S-metilo, Anilazin, Captan, Captafol, Dazomet, Diclomezine, Fenoxanil, Folpet, Fenpropidin, Famoxadone, Fenamidon,

25 Othililone, Probenazol, Proquinazid, Pyroquilon, Quinoxifen, Tricyclazol, la 5-cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluor-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, la 2-butoxi-6-yodo-3-propil-cromen-4-ona, la dimetilamida del ácido 3-(3-bromo-6-fluor-2-metil-indol-1-sulfonil)-[1,2,4]triazol-1-sulfónico;

Carbamatos y ditiocarbamatos

- 30 • ditiocarbamatos: Ferbam, Mancozeb, Maneb, Metiram, Metam, Propineb, Thiram, Zineb, Ziram;
- carbamatos: Diethofencarb, Flubenthiavalicarb, Iprovalicarb, Propamocarb, el

- 38 -

éster de metilo del ácido 3-(4-cloro-fenil)-3-(2-isopropoxycarbonilamino-3-metil-butirilamino)-propiónico, el éster de (4-flúorfenilo) del ácido N-(1-(1-(4-cianofenil)etanosulfonil)-but-2-il)carbámico;

Otros fungicidas

- 5 • guanidinas: Dodine, Iminoctadine, Guazatine;
- antibióticos: Kasugamycin, Polyoxine, Streptomycin, Validamycin A;
- compuestos organometálicos: sales de fentina;
- compuestos heterocíclicos azufrados: Isoprothiolane, Dithianon;
- compuestos órganofosforados: Edifenphos, Fosetyl, Fosetyl-aluminio,
- 10 Iprobenfos, Pyrazophos, Tolclofos-metilo, ácido fosforoso y sus sales;
- compuestos órganoclorados: Thiophanat metilo, Chlorothalonil, Dichlofluanid, Tolyfluanid, Flusulfamide, Phthalid, hexaclorobenceno, Pencycuron, Quintozen;
- derivados de nitrofenilo: Binapacryl, Dinocap, Dinobuton;
- 15 • productos activos inorgánicos: caldo de Bordeaux, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;
- otros: Spiroxamine, Cyflufenamid, Cymoxanil, Metrafenon.

Ejemplos de síntesis

(3',4',5'-Trifluórbifenil-2-il)amida del ácido 2-metil-4-trifluórmethyltiazol-5-carboxílico (Ejemplo I.1):

Se añaden a una solución de 0,40 g del ácido 2-metil-4-trifluórmethyltiazol-5-carboxílico y 0,38 g de trietilamina en 30 ml de diclorometano, a la temperatura ambiente, 0,42 g de la 3',4',5'-trifluórbifenil-2-ilamina y 0,72 g del cloruro de bis-(2-oxo-3-oxazolidinil)fosforilo. La mezcla se agitó durante 16 horas a la temperatura ambiente. A continuación se lavó sucesivamente dos veces con ácido clorhídrico diluido, dos veces con solución acuosa de hidrógenocarbonato de sodio y una vez con agua. La fase orgánica se secó y se concentró por evaporación. El producto en bruto se purificó por medio de una cromatografía en columna con ciclohexano/metil-terc.-butiléter 1:2 sobre gel de sílice. De este modo se obtuvieron 0,61 g del producto deseado en forma de cristales de color pardo claro con un punto de fusión de 148-152°C.

De conformidad con la rutina que ha sido indicada aquí se prepararon los

- 39 -

compuestos de la fórmula general I que están indicados en la tabla 25 siguiente, en la que A significa A1.

Tabla 25

Ejemplo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	p	w	Caracterización (punto de fusión o ¹ H-RMN)
I.1	CF ₃	CH ₃	H	3,4,5-F ₃	-	0	O	148-152°C
I.2	CF ₃	CH ₃	H	2,4,5-F ₃	-	0	O	112-116°C
I.3	CH ₃	CH ₃	H	3,4,5-F ₃	-	0	O	123-128°C
I.4	CH ₃	CH ₃	H	2,4,5-F ₃	-	0	O	150-154°C

5 Ejemplos de actividad contra los hongos dañinos

La actividad fungicida de los compuestos de la fórmula I puede ponerse de manifiesto por medio de los ensayos siguientes:

Los productos fueron preparados en forma de una solución madre con 25 mg de producto activo, que se completó hasta 10 ml con una mezcla constituida por acetona y/o dimetilsulfóxido y el emulsionante Uniperol® EL (agente humectante con actividad emulsionante y dispersante a base de alquilfenoles etoxilados) en una relación en volumen entre disolvente / emulsionante de 99 a 1. A continuación se completó con agua hasta 100 ml. Esta solución madre se diluyó con la mezcla de disolvente / emulsionante / agua descrita hasta la concentración de producto activo indicada más abajo.

Ejemplo de aplicación 1 - Actividad curativa contra la roya para el trigo provocada por *Puccinia recondita*.

Se inocularon hojas de plántones de trigo, cultivados en tiestos, de la variedad "Kanzler", con una suspensión de esporas de la roya parda (*Puccinia recondita*). A continuación se dispusieron los tiestos durante 24 horas en una cámara con una elevada humedad del aire (90 hasta 95 %) y a 20 hasta 22°C. Durante este tiempo germinaron las esporas y las hifas penetraron en el tejido de las hojas. Las plantas infectadas se pulverizaron al día siguiente con una suspensión acuosa con la concentración de producto activo que ha sido dada más adelante, hasta que gotearon. La suspensión o la emulsión se prepararon como se ha descrito más arriba. Tras el

- 40 -

secado del recubrimiento aplicado por pulverización se cultivaron las plantas de ensayo en el invernadero a temperaturas comprendidas entre 20 y 22°C y con una humedad relativa del aire comprendida entre un 65 y un 70 % durante 7 días. A continuación se determinó la magnitud del desarrollo de los hongos de la roya sobre las hojas.

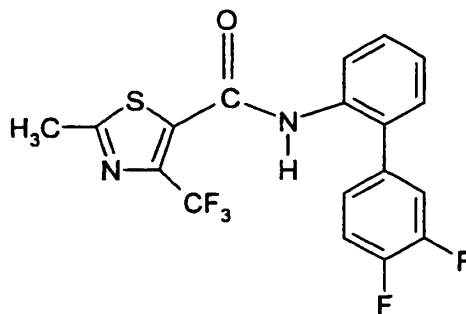
En este ensayo mostraron las plantas tratadas con 250 mg/l de los compuestos I.1, I.2, I.3 y I.4 de la tabla 25, un ataque máximo de un 1 %, mientras que las plantas no tratadas habían sido atacadas en un 90 %.

Ejemplo de aplicación 2 - Actividad contra la enfermedad de las manchas por sequía de los tomates, provocada por *Alternaria solani*.

Se pulverizaron, hasta que gotearon, hojas de plantas de cultivadas en tiestos de la variedad "Goldene Königin" con una suspensión acuosa con la concentración de producto activo indicada más abajo. Al día siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani* en solución de biomalta al 2 % con una densidad de $0,12 \times 10^6$ esporas/ml. A continuación se depositaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua, a temperaturas comprendidas entre 20 y 22°C. Al cabo de 5 días se había desarrollado la enfermedad sobre las plantas de control no tratadas, pero infectadas, con una intensidad tal, que pudo determinarse a simple vista el ataque en %.

En este ensayo, las plantas tratadas con 4 ppm del compuesto I.1 de la tabla 25, mostraron un ataque de un 7 %, mientras que las plantas no tratadas habían sido atacadas en un 90 %.

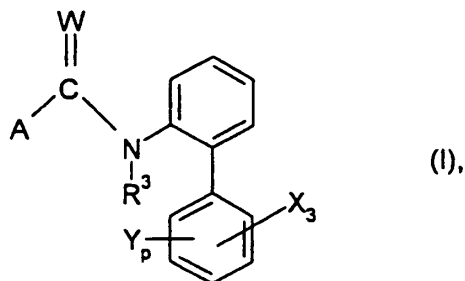
Las plantas, tratadas con 4 ppm del compuesto comparativo, conocido por la publicación WO 2003/066609



mostraron un ataque del 20 %.

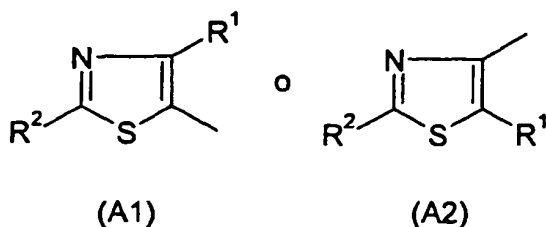
REIVINDICACIONES

1.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I



en la que las variables tienen los significados siguientes:

5 A significa



X significa halógeno;

Y significa ciano, nitro, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, metoxi o metiltio;

10 p significa 0 o 1;

R¹ significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;

R² significa hidrógeno, metilo o significa halógeno;

R³ significa hidrógeno, metilo o etilo;

15 W oxígeno o azufre.

2.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I según la reivindicación 1, en la que las variables tienen los significados siguientes:

X significa F o cloro;

Y significa alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o metoxi;

p significa 0 o 1;

R¹ significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;

R² significa hidrógeno, metilo o significa halógeno;

- 42 -

R³ significa hidrógeno o metilo;

W significa oxígeno.

3.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 o 2, en la que las variables tienen los significados siguientes:

5 X significa F o cloro;

Y significa metilo, difluórmétilo, trifluórmétilo o metoxi;

p significa 0 o 1;

R¹ significa hidrógeno, F, Cl, metilo, fluórmétilo, difluórmétilo, clorofluórmétilo, clorodifluórmétilo, diclorofluórmétilo o trifluórmétilo;

10 R² significa hidrógeno, F, Cl o metilo;

R³ significa hidrógeno o metilo;

W significa oxígeno.

4.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, en la que las variables tienen los significados siguientes:

15 X significa F o cloro;

p significa cero;

R¹ significa hidrógeno, F, Cl, metilo, fluórmétilo, difluórmétilo, clorofluórmétilo, clorodifluórmétilo, diclorofluórmétilo o trifluórmétilo;

R² significa hidrógeno, F, Cl o metilo;

20 R³ significa hidrógeno;

W significa oxígeno.

5.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4, en la que las variables tienen los significados siguientes:

X significa F o cloro;

25 p significa cero;

R¹ significa hidrógeno, F, Cl, metilo, fluórmétilo, difluórmétilo, clorofluórmétilo, clorodifluórmétilo, diclorofluórmétilo o trifluórmétilo;

R² significa hidrógeno, Cl o metilo;

R³ significa hidrógeno;

30 W significa oxígeno.

6.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, en la que el sustituyente A tiene el significado de A1.

- 43 -

7.- Anilidas de ácidos tiazolcarboxílicos de la fórmula I según la reivindicación 1, elegidos entre el grupo constituido por la N-(3',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2-metil-4-trifluórmethyltiazol-5-carboxílico, la N-(2',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2-metil-4-trifluórmethyltiazol-5-carboxílico, la N-(3',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2,4-dimetiltiazol-5-carboxílico y la N-(2',4',5'-trifluorbifenil-2-il)-amida del ácido 2,4-dimetiltiazol-5-carboxílico.

8.- Agente para la lucha contra los hongos dañinos, que contiene una cantidad fungicida de, al menos, un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7 y, al menos, un aditivo inerte.

9.- Procedimiento para la lucha contra los hongos dañinos patógenos para las plantas, **caracterizado porque** se tratan los hongos dañinos, su medio ambiente y/o los materiales, las plantas, los terrenos o las semillas que deben ser protegidos contra el ataque de los hongos, con una cantidad fungicidamente activa de, al menos, un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7.

10.- Empleo de los compuestos I según una de las reivindicaciones 1 a 7 para la lucha contra los hongos dañinos patógenos para las plantas.

11.- Semillas, que contienen al menos un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7 en una cantidad comprendida entre 1 y 1.000 g/100 kg de semilla.

12.- La 3',4',5'-trifluorbifenil-2-ilamina.