



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. 05053823

54 TÍTULO ~~SABOR~~ → Aminotrazolopirimidinas, prodimiendos
y productos intermedios para su obtencion, productos que
los contienen y el uso de la misma para combatir
hongos malos

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C07D484/004

71 SOLICITANTE Bayer Aktiengesellschaft

DOMICILIO Ludwigshafen República Federal de Alemania

74. APODERADO Emilio FEREIRO

22. BOGOTÁ, D. C., cc 438.019 Ugueta



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

INDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 85853823 00000000 Folios: 138
Fecha (AMP): 2005-05-02 16:59:14
Tramite : 011 PCT-PATENT 779 FASE NUPY 411 DEFENSOR
Remedios: 2004 ATUSTRON DE NUEVOS PROCEDIMIENTOS

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

- 1 ☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ Capítulo I. ☒ Capítulo II.

2
SOLICITANTE
(71)

Nombre: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de la República Federal de Alemania

Dirección: 67056 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania
Domicilio: Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número _____

3
REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: EMILIO FERRERO
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@camyo.com
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número 438.019 T.P 31.929

4
INVENTOR (ES)
(72)

- 1- Jordi TORMO I BLASCO
Carl-Benz-Str. 10-3,
68514 Laudendach,
República Federal de Alemania.
3- Bernd MÜLLER
Stockingerstr. 7,
67227 Frankenthal ,
República Federal de Alemania.
5- Wassilios GRAMMENOS
Alexander-Fleming-Str. 13,
67071 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania.
7- Andreas GYPSE
B 4 4,
68159 Mannheim,
República Federal de Alemania.
9- Peter SCHÄFER
Römerstr. 1,
67308 Ottersheim,
República Federal de Alemania.
11- Anja SCHWÖGLER
Heinrich -Lanz-Str. 3,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania.
13- Siegfried STRATHMANN
Donnersbergstr. 9,
67117 Limburgerhof,
República Federal de Alemania.
15- Reinhard STIERL
Jahnstr. 8,
67251 Freinsheim,
República Federal de Alemania.

- 2- Carsten BLETNER
Richard-Wagner-Str. 48,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania.
4- Markus GEWEHR,
Goethestr. 21,
56288 Kastellaun,
República Federal de Alemania.
6- Thomas GROTE
Im Hoehnhausen 18,
67157 Wachenheim,
República Federal de Alemania.
8- Joachim RHEINHEIMER
Merziger Str. 24,
67063 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania.
10- Frank SCHIEWECK
Lindenweg 4,
67258 Heßheim,
República Federal de Alemania
12- Eberhard AMMERMAN
Von-Gagern-Str.2,
64646 Heppenheim,
República Federal de Alemania.
14- Ulrich SCHÖFL
Erlenstr. 8,
68782 Brühl,
República Federal de Alemania.

5

PCT (86)Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/012277Fecha: 4 de noviembre 2003Publicación Internacional No. WO 2004/041825 A1Fecha: 21 de mayo de 2004

6

Título (54)**5-ALQUIL-7-AMINOTRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS Y PRODUCTOS INTERMEDIOS PARA SU OBTENCIÓN, PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS N CIV S**

7

Clasificación Internacional (51) C07D 487/04

8

Prioridad**(33) País de Origen****(32) Fecha****(31) Número de Solicitud**SI ☒ NO ☐DE.7 de noviembre de 2002102 52 261.8

9

Comprobante de pago No.: 05-35.939**Fecha: 16 de mayo de 2005**

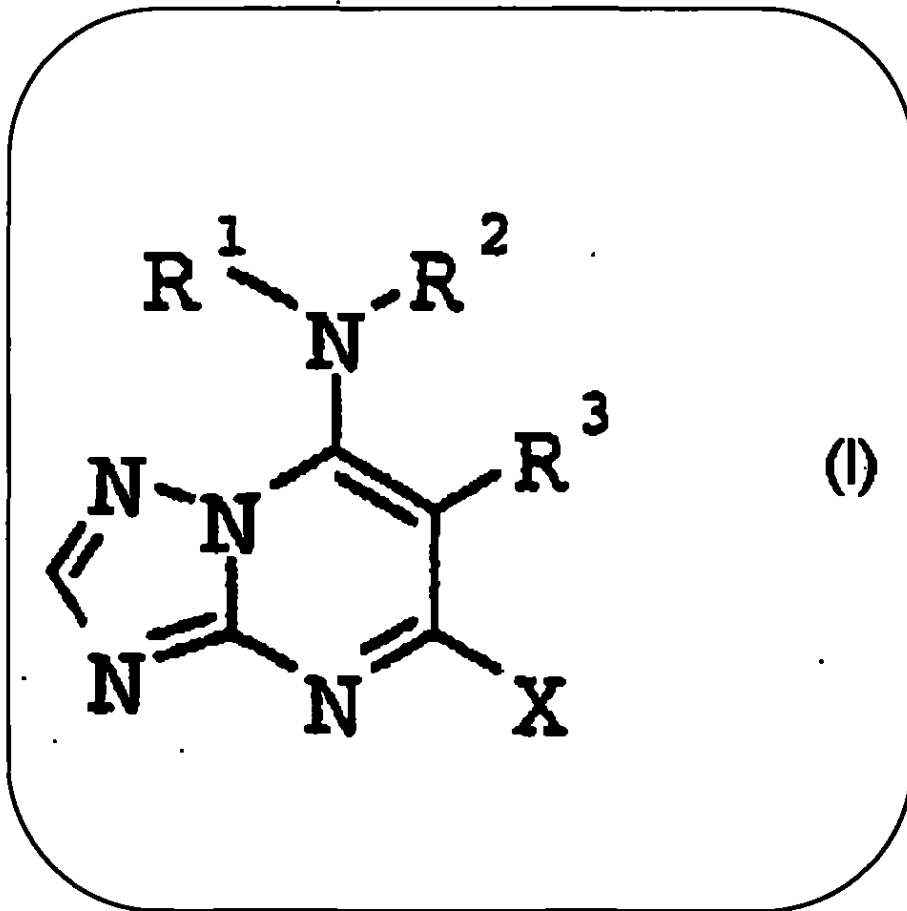
10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 443.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: (Ver hoja de documentos anexos)

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

MRE/mm-Id-4099.

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República
Federal de Alemania.

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831, ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519, y EMILIO FERRERO, tpa. 31929, domiciliados en la Carrera 4ª N° 73-36, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1º del Artículo 843 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero, y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso. Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me(nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales, el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas y de servicios, el depósito de nombres comerciales y enseñanzas, su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria, y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos, acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistir, cancelar, recibir, renunciar y ratificar los actos hechos por agentes oficiales.

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

Firma
ppa. Welzel

(Für Patente, Modelle und Zeichnungen; Warenzeichen und Servicezeichen; Handelsnamen und -zeichen).

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterscheidender (de)

BASF Aktiengesellschaft.

wohnhaft in Ludwigshafen, República Federal
de Alemania

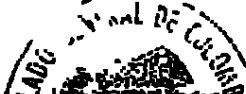
verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831, ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519, und EMILIO FERRERO, tpa. 31929, wohnhaft in der Carrera 4ª N° 73-36, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 843 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fällen der Hauptvertreter, oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten, oder kolumbianischen Konsul im Auslande, und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendet, einer oder anderen, ordnungswise werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie ausüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Ausserdem, und unter dieselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unsere) industriellen Eigentum zu erhalten, und gegen den Wettbewerb zu diesem Zweck, wir erteilen ihnen Bevollmächtigung, um die Angelegenheiten der folgenden Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem, vor denen mit Verwaltungs, streitigem, Verwaltungs (und gerichtlichem) Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erhaltung von Patenten, Modellen und Zeichnungen, Registrierung von Waren, Spandiel-Defensives, und Servicezeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen und Marken; ihre Erneuerung und Übertragung; Name und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragsklausen; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtmassnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am 17. März 1989

in D-6700 Ludwigshafen

Unterschrift
ppa. Richters



U.R.Nr. 1407/89

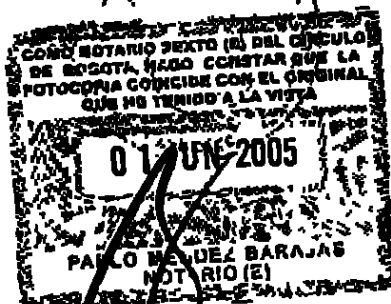
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorstehenden, eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein handelnden Herren:

1. Dr. Gunther W e l z e l , Chemiker in Ludwigshafen am Rhein,
2. Dr. Peter R i c h t e r s , Chemiker in Ludwigshafen am Rhein.

Die Herren Dr. Welzel und Dr. Richters sind mir persönlich bekannt.

Aufgrund heutiger Einsichtnahme in das Handelsregister beim Amtsgericht Ludwigshafen am Rhein HR B 3000 bescheinige ich, daß die Herren Dr. Welzel und Dr. Richters als Prokuristen gemeinschaftlich zur Vertretung und Zeichnung der Firma BASF Aktiengesellschaft mit dem Sitz in Ludwigshafen am Rhein berechtigt sind.

Ludwigshafen am Rhein, den 17. März 1989



[Handwritten signature]

Dr. v. Richter
als ständiger Vertreter
des H.C. ...

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors
Thomas Walter

als amtlich bestellter Vertreter des Notars Justizrat Dr. Kohler in Ludwigshafen am Rhein und die Echtheit des beigedruckten Dienststempels werden hiermit bestätigt. Zugleich wird bescheinigt, daß der Vorgenannte zur Vornahme der Amtshandlung befugt war.

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

[Handwritten signature: Franz Serfas]
(Franz Serfas)



Kostenvermerk Gebühr 20.-- DM

LUZ ARRIAGA DE ...
DIRECTORA ...
Bogotá No. 559 ...



El suscrito Cónsul General de Colombia en Frankfurt
am Main, República Federal de Alemania, vistos los
documentos presentados por los interesados,

C E R T I F I C A:

Que el señor Thomas Walter-----
quien como Notario en Ludwigshafen am Rhein-----
autenticó la(s) firma(s) del(os) signatario(s) del
Poder precedente, ejercía las funciones indicadas y
su firma corresponde a la registrada ante el Tribunal Re-
gional de Frankenthal (Pfalz)-----
que la compañía RASF Aktiengesellschaft-----
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
de la República Federal de Alemania y cumple su objeto
conforme a las mismas; que el(los) señor(es) Dr. Gunther
WELZEL y el Dr. Peter RICHTERS-----
quien(es) en sus carácter(es) de apoderados-----
----- y cuya(s) firma(s)-----
(fueron) autenticada(s) ante el Notario-----
----- es(son)-----
te(s) legal(es) en este país.

El Cónsul General no asume responsabilidad por el con-
tenido del documento.

Esta Certificación se expide en Frankfurt am Main,
el seis de Abril de mil novecientos ochenta y nueve.

Frankfurt a M 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Am 405.6 - der Law 6.6.4.4



M-0077

Mertha Niño de Stand
Mertha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

Die konsularische Legalisierung ist notwendig

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO Según los artículos 65 del C de P. C. y 480 del C. de
Co, si el poderdante es una sociedad, el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de
su existencia, que ejerce su objeto social, que quien confiere el poder es su representante y puede otorgar
poder, seguidamente autenticar la firma de éste

SECRET

COMO NOTARIO SUJETO (E) DEL CIRCULO
DE BOBOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

01 JUN 2005

PAULO MEHUEZ GARCIA
NOTARIO (E)

8

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES

Boletín No 85464
12 ABR 1989

Martha Nieto

ACUÑA

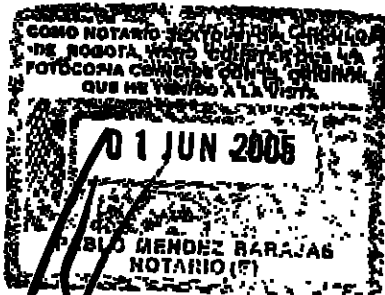
6

2

COMO NOTARIO SECTO (S) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HACIO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
01 JUN 2005
PABLO MENDEZ BARRALAS
NOTARIO (S)

Die konsularische Legalisierung ist notwendig.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según los artículos 85 del C. de P. C. y 480 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social, que quien confiere el poder es su representante y puede otorgar poder, seguidamente autenticar la firma de éste.



7

TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 2056

de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

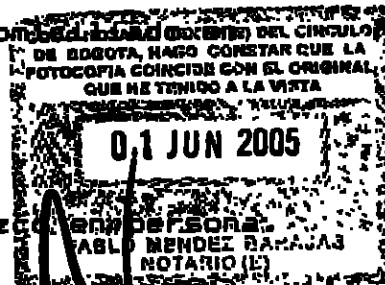
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

Protocolo notarial No. 1407/89

Certifico la autenticidad de las firmas anteriores puestas ante mí, por los señores:

1. Dr. Gunther W e l z e l , químico, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein,
2. Dr. Peter R i c h t e r s , químico, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein.

A los doctores Walzel y Richters los conozco



Certifico, por haber tenido a la vista el registro de comercio HR B 3000, del juzgado de Ludwigshafen, que los doctores Wizel y Richters, en su calidad de apoderados, están facultados para representar conjuntamente y firmar por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, con sede en Ludwigshafen.

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

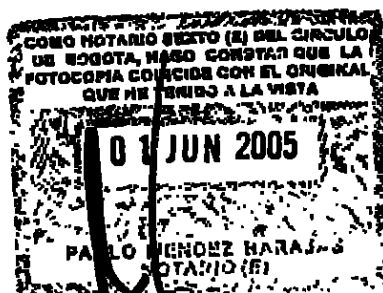
Notario de Ludwigshafen

Th. Walter

Asesor del notario como representante oficialmente designado del notario Dr. Siegfried Kohler

Se certifica la autenticidad de la firma anterior del asesor del notario, consejero de justicia Dr. Kohler, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein, y la del sello oficial que la acompaña. Al mismo tiempo se certifica que el mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

Frankenthal (Pfalz), veintiuno de marzo de mil novecientos ochenta y nueve



LUZ ARRIAGA DE HERRERA
TRADUCTORA INTERPRETE OFICIAL
Certificación No. 599 Minutaria

El Presidente del Tribunal Regional

Fdp.: firma ilegible (sello redondo:)

(Fränz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

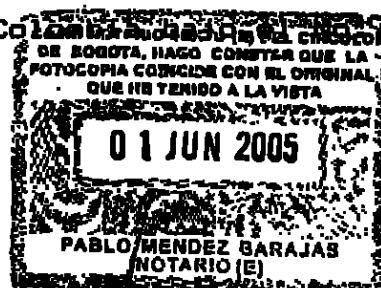
Nota: Derrechos 20,-- DM

EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas anteriores por el
Consulado de General de Colombia en Frankfurt, bajo el No.
0077 (Certificación consular) del 6 de abril de 1989 y del
Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia, Resolución
85061 del 24 de abril de 1989.

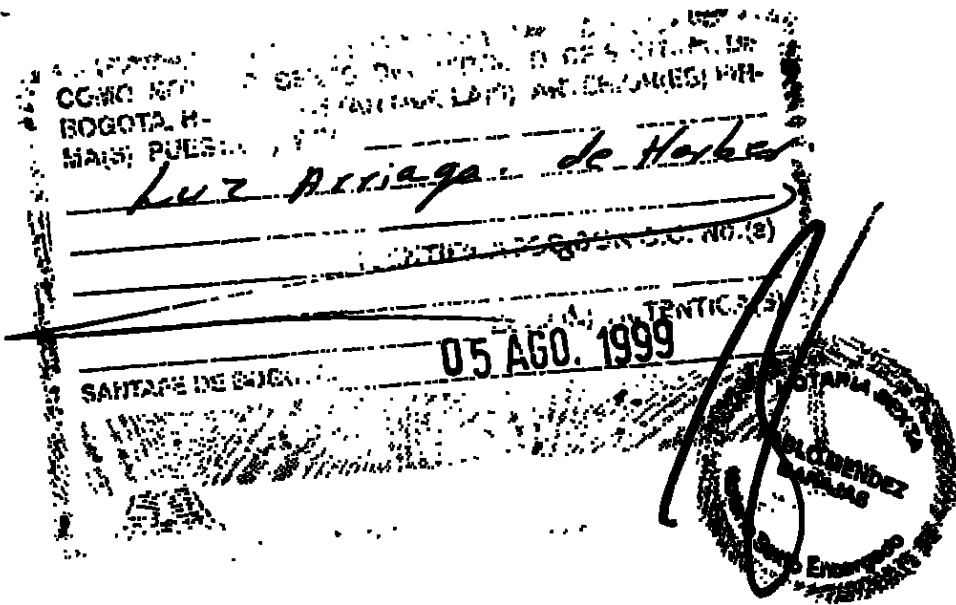
Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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

Bogotá, 26 de abril de 1989



LUZ ARRIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Luz Arriaga de Herben
Regulación No. 599 Minjusticia



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá 28 JUN 1995 No. 89045

HACE CONSTAR

Que el señor Luz DE HERRERA

cuya firma aparece al pie del presente documento, desempeña en esa fecha las funciones allí indicadas.

Division Consular

Encargado

DE BOGOTÁ, HACER CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE ME VENIDO A LA VISTA

01 JUN 2005

PABLO MEJÍEZ BARAJAS

NOTARIO (E)

881051599954

B C C 18
SANTANA CORPORACION

DECLARACION Y PAGO DEL
IMPUESTO D
TIMBR
NACIONAL

16 013 01 000045 1

16 013 01 000045 1

Código 03 Teléfono 2120100

1 Administración de Impuestos de:

BOGOTA

2 Documento de Identificación (marque X)

D.V. 3

4 Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres).

CAVELIER ABOGADOS

C.C. & T.I. C X NIT. A Y No. 880041367

D.V. 3

5 Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres).

FORERO ROCHA JAIME

C.C. & T.I. C X NIT. A Y No. 19'301.629

D.V. 3

6 Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres).

BOGOTA

Departamento CUNDINAMARCA

7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la cédula 4)

Cra. 4a. No. 72-35

8 Relación oficial (copie) de documento(s), indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción.

TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989

PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER

COLO 0361-52-218-8

REVISADO
ESTAMPADO SORDOS EN PODERES
ESTAMPADO SORDOS EN PODERES
ESTAMPADO SORDOS EN PODERES

COMO NOTARIO ENTO (N) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
01 JUN 2005
ABLO MENDOZ ESPAJAS
NOTARIO (E)

Responsable del pago
Nombre C.C. No. 19'301.629

1. VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	750
2. Rendición	0
3. Impuesto de nómina	0
4. TOTAL A PAGAR (suma de 1 + 2 + 3)	750
5. Valor del impuesto	750
6. Valor del impuesto	750
7. Valor del impuesto	750
8. Valor del impuesto	750
9. Valor del impuesto	750
10. Valor del impuesto	750
11. Valor del impuesto	750
12. Valor del impuesto	750
13. Valor del impuesto	750
14. Valor del impuesto	750
15. Valor del impuesto	750
16. Valor del impuesto	750
17. Valor del impuesto	750
18. Valor del impuesto	750
19. Valor del impuesto	750
20. Valor del impuesto	750
21. Valor del impuesto	750
22. Valor del impuesto	750
23. Valor del impuesto	750
24. Valor del impuesto	750
25. Valor del impuesto	750
26. Valor del impuesto	750
27. Valor del impuesto	750
28. Valor del impuesto	750
29. Valor del impuesto	750
30. Valor del impuesto	750
31. Valor del impuesto	750
32. Valor del impuesto	750
33. Valor del impuesto	750
34. Valor del impuesto	750
35. Valor del impuesto	750
36. Valor del impuesto	750
37. Valor del impuesto	750
38. Valor del impuesto	750
39. Valor del impuesto	750
40. Valor del impuesto	750
41. Valor del impuesto	750
42. Valor del impuesto	750
43. Valor del impuesto	750
44. Valor del impuesto	750
45. Valor del impuesto	750
46. Valor del impuesto	750
47. Valor del impuesto	750
48. Valor del impuesto	750
49. Valor del impuesto	750
50. Valor del impuesto	750
51. Valor del impuesto	750
52. Valor del impuesto	750
53. Valor del impuesto	750
54. Valor del impuesto	750
55. Valor del impuesto	750
56. Valor del impuesto	750
57. Valor del impuesto	750
58. Valor del impuesto	750
59. Valor del impuesto	750
60. Valor del impuesto	750
61. Valor del impuesto	750
62. Valor del impuesto	750
63. Valor del impuesto	750
64. Valor del impuesto	750
65. Valor del impuesto	750
66. Valor del impuesto	750
67. Valor del impuesto	750
68. Valor del impuesto	750
69. Valor del impuesto	750
70. Valor del impuesto	750
71. Valor del impuesto	750
72. Valor del impuesto	750
73. Valor del impuesto	750
74. Valor del impuesto	750
75. Valor del impuesto	750
76. Valor del impuesto	750
77. Valor del impuesto	750
78. Valor del impuesto	750
79. Valor del impuesto	750
80. Valor del impuesto	750
81. Valor del impuesto	750
82. Valor del impuesto	750
83. Valor del impuesto	750
84. Valor del impuesto	750
85. Valor del impuesto	750
86. Valor del impuesto	750
87. Valor del impuesto	750
88. Valor del impuesto	750
89. Valor del impuesto	750
90. Valor del impuesto	750
91. Valor del impuesto	750
92. Valor del impuesto	750
93. Valor del impuesto	750
94. Valor del impuesto	750
95. Valor del impuesto	750
96. Valor del impuesto	750
97. Valor del impuesto	750
98. Valor del impuesto	750
99. Valor del impuesto	750
100. Valor del impuesto	750

CONTRIBUYENTE

DEM-31-V-88

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLE: CAVEYES

Señor Jefe de la

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

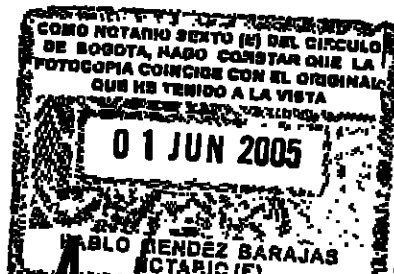
E.

S.

D.

Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89



Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder conferido en el doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER.

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

Acepto:

EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-780-2

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá-c.mparecio, el Doctor SMILIO FRAJIA

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 438.91
expedida en VAQUIN y la tarjeta profesional
número 31.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: R.D. MUJAS (Mujer)
y declaró que la firma que aparece en el es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá-c.mparecio, el Doctor 6 ram

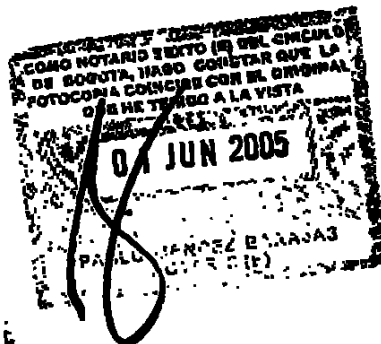
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 287274
expedida en 27 y la tarjeta profesional
número 877 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación
y declaró que la firma que aparece en el es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª N°. 72-35
BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

07
Colombia

12

0000054041

CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach
Germany
Citizen of Spain
Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller
Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Thomas Grote
Im Hoehnhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
Andreas Gypser
B 4 4, 68159 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
Peter Schäfer
Römersstr.1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany
Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Hefenheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

CAVELIER ABOGADOS
WPT/DERE-343

CA Assignment Form 01 11/98

Anju Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Eberhard Ammermann
Von-Gagern-Str.2, 64646 Heppenheim
Germany
Citizen of Germany
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Germany
Citizen of Germany
Ulrich Schöfl
Luftschiffring 22c, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
Reinhard Stierl
Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany

→
declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)
inventor(es) de la invención:

5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidinas,
procedimientos y productos interme-
dios para su obtención, composiciones
que las contienen y el uso de las
mismas para combatir hongos nocivos

declaro(amos) así mismo que cedo(emos) y
transfiero(emos), sin limitación, a favor de la sociedad

BASF AKTIENGESellschaft

constituida y existente de conformidad con las leyes de

Alemania

domiciliada en

67056 Ludwigshafen, Alemania

todos los derechos inherentes a dicha invención y que la
citada Compañía queda facultada para solicitar en su
nombre la patente correspondiente en la República de
Colombia.

state(s) under oath to be sole and true inventor(s) of the
invention:

5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes and inter-
mediates for their preparation, compositions comprising
them and their use for controlling harmful fungi

state as well, that assign, without reservations or limitations
in favour of

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Germany

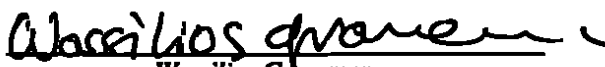
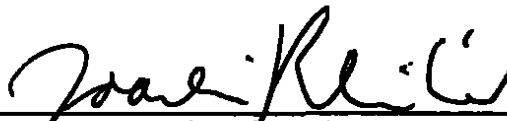
domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

all rights inherent to said invention and that the above
mentioned company hereby is enabled to apply, in its name,
for the corresponding patent in the Republic of Colombia.

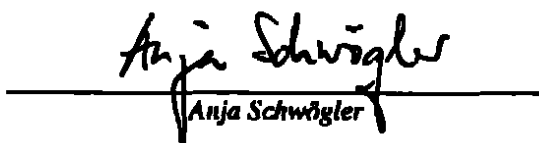
Dado y firmado hoy Given and signed this **17. Juli 2003**

Firma Signature


Jordi Torro i Blasco
Carsten Bleitner
Bernd Müller
Markus Jewehr
Wassilios Grammenos
Thomas Grote
Andreas Gypser
Joachim Rheinheimer
Peter Schäfer



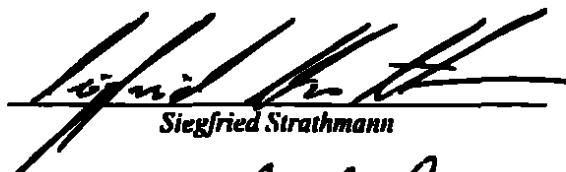
Frank Schieweck



Anja Schwögl



Eberhard Ammermann



Siegfried Strathmann



Ulrich Schöfl



Reinhard Stierl

AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUO)

NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

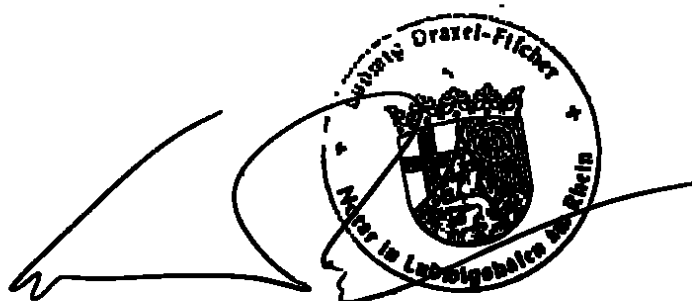
A los días del mes de de 200

On this 17th day of July 2003

ante mí. Notario Público de

before me, a Notary Public at Ludwigshafen
Federal Republic of Germany

compareció(eron) personalmente

personally appeared Jordi Tormo i Blasco, Carsten
Blettner, Bernd Müller, Markus Gewehr,
Wassilios Grammenos, Thomas Grote, Andreas
Gypser, Joachim Rheinheimer, Peter Schäfer,
Frank Schieweck, Anja Schwöglar, Eberhard
Ammermann, Siegfried Strathmann, Ulrich
Schöfl and Reinhard Stierla quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y
quien(es) tiene(n) capacidad legal para otorgarlo.to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who ~~has~~ (have)
legal capacity to execute it.

Notario Público

Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

CAVELIER ABOGADOS

WPPDERE-343

CO Affidavit Form 01 11/98

U.R.Nr. 1913/2003

I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

1. Mr. Jordi **Tormo i Blasco**, residing at Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Germany, personally known to me,
2. Mr. Carsten **Blettner**, residing at Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
3. Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockingerstraße 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
4. Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
6. Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Hoehnhausen 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
7. Mr. Andreas **Gypser**, residing at B 4-4, 68159 Mannheim, Germany, personally known to me,
8. Mr. Joachim **Rheinheimer**, residing at Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
9. Mr. Peter **Schäfer**, residing at Im Bügen 16, 67281 Kirchheim, Germany, personally known to me,
10. Mr. Frank **Schieweck**, residing at Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Germany, personally known to me,
11. Mrs. Anja **Schwögl**, residing at Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,

- 18
12. Mr. Eberhard **Ammermann**, residing at Von-Gagern-Str. 2, 64646 Heppenheim, Germany, personally known to me,
 13. Mr. Siegfried **Strathmann**, residing at Donnersbergstraße 9, 67117 Limburgerhof, Germany, personally known to me,
 14. Mr. Ulrich **Schöfl**, residing at Luffschifftring 22c, 68782 Brühl, Germany, personally known to me,
 15. Mr. Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstraße 8, 67251 Freinsheim, Germany, personally known to me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 17th day of July, 2003



Notar

Wert: 5.112,92 Euro

19

A P O S T I L L E

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

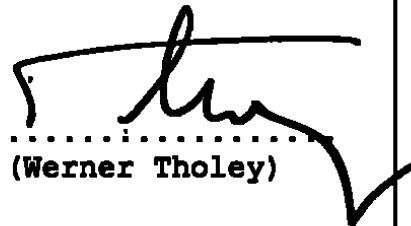
1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
Draxel-Fischer
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Ludwig Draxel-Fischer
in Ludwigshafen am Rhein

Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 28. Juli 2003
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb.- 732-737/03

9. Siegel/Stempel: 10. Unterschrift




.....
(Werner Tholey)

Kostenvermerk:
Gebühr 12,00 €

20

TRADUCCIÓN OFICIAL 089/2005 DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL APROBADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE LA REPÚBLICA DE COLOMBIA Y MEDIANTE EL CUAL JORDI TORMO I BLASCO, CARL-BENZ-STR. 10-3, 69514 LAUDENBACH, ALEMANIA, CIUDADANO ESPAÑOL; CARSTEN BLETTNER, RICHARD-WAGNER-STR 48, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; BERND MÜLLER STOCKINGERSTR. 7, 67227 FRANKENTHAL, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; MARKUS GEWEHR, GOETHESTR. 21, 56288 KASTELLAUN, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; WASSILIOS GRAMMENOS ALEXANDER-FLEMING-STR. 13, 67071 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, CIUDADANO GRIEGO; THOMAS GROTE IM HOEHNHAUSEN 18, 67157 WACHENHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMAN; ANDREAS GYSER, B 4 4, 68159 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; JOACHIM RHEINHEIMER, MERZIGER STR. 24, 67063, LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; PETER SCHÄFER, RÖMERSTR.1, 67308 OTTERSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; FRANK SCHIEWECK, LINDENWEG 4, 67258 HESSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; ANJA SCHWÖGLER, HEINRICH-LANZ-STR. 3, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; EBERHARD AMMERMAN VON-GAGERN-STR.2, 64646 HEPPENHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; SIEGFRIED STRATHMANN, DONNERSBERGSTR. 9, 67117 LIMBURGERHOF, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; ULRICH SCHÖFT, LUFTSCHIFFRING 22C, 68782 BRÜHL, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; REINHARD STIERL JAHNSTR. 8, 67251 FREINSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, DECLARAN BAJO JURAMENTO SER LOS ÚNICOS Y VERDADEROS INVENTORES DE LA INVENCION 5-ALQUIL-7-AMINOTRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS Y PRODUCTOS INTERMEDIOS PARA SU OBTENCION, COMPOSICIONES QUE LAS CONTIENEN Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, Y DECLARAN POR EL PRESENTE QUE CEDEN Y TRANSFIEREN SIN LIMITACION DICHA

INVENCION A BASF AKTIENGESSELLSCHAFT, EMPRESA ORGANIZADA Y EXISTENTE BAJO LAS LEYES DE ALEMANIA, DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, JUNTO CON TODOS LOS DERECHOS INHERENTES Y QUE DICHA COMPAÑIA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE EN LA REPUBLICA DE COLOMBIA.

DADO Y FIRMADO HOY 17 DE JULIO DE 2003

15 FIRMAS ILEGIBLES, CORRESPONDIENTES A JORDI TORMO I BLASCO, CARSTEN BLETTNER, BERND MÜLLER, MARKUS GEWEHR, WASSILIOS GRAMMENOS, THOMAS GROTE, ANDREAS GYPSE, JOACHIM RHEINHEIMER, PETER SCHÄFER, FRANK SCHIEWECK, ANJA SCHWÖGLER, EBERHARD AMMERMAN, SIEGFRIED STRATHMAN, ULRICH SCHÖFL, REINHARD STIERL.

AUTENTICACION NOTARIAL EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, DE FECHA 17 DE JULIO DE 2003 PARA CERTIFICAR LA COMPARECENCIA PERSONAL DE JORDI TORMO I BLASCO, CARSTEN BLETTNER, BERND MÜLLER, MARKUS GEWEHR, WASSILIOS GRAMMENOS, THOMAS GROTE, ANDREAS GYPSE, JOACHIM RHEINHEIMER, PETER SCHÄFER, FRANK SCHIEWECK, ANJA SCHWÖGLER, EBERHARD AMMERMAN, SIEGFRIED STRATHMAN, ULRICH SCHÖFL, REINHARD STIERL PARA CERTIFICAR SU FIRMA EN EL DOCUMENTO PRECEDENTE Y SU CAPACIDAD LEGAL PARA FIRMARLO.

FIRMADO: NOTARIO PÚBLICO

U.R NR. 1913/2003

Yo, Ludwig Draxel-Fisher, notario público en Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente testifico y confirmo que las siguientes firmas de

1. JORDI TORMO I BLASCO, residente en CARL-BENZ-STR. 10-3, 69514 LAUDENBACH, ALEMANIA, personalmente conocido mío;
2. CARSTEN BLETTNER, residente en RICHARD-WAGNER-STR 48, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío;
3. BERND MÜLLER residente en STOCKINGERSTR. 7, 67227 FRANKENTHAL, ALEMANIA, personalmente conocido mío

4. MARKUS GEWEHR, residente en GOETHESTR. 21, 56288 KASTELLAUN, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

5. WASSILIOS GRAMMENOS residente en ALEXANDER-FLEMING-STR. 13, 67071 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

6. THOMAS GROTE IM HOEHNHAUSEN 18, 67157 WACHENHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío

7. ANDREAS GYSER, residente en B 4 4, 68159 MANNHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío

8. JOACHIM RHEINHEIMER, residente en MERZIGER STR. 24, 67063, LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

9. PETER SCHÄFER, residente en RÖMERSTR. 1, 67308 OTTERSHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío

10. FRANK SCHIEWECK, residente en LINDENWEG 4, 67258 HESSHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío

11. ANJA SCHWÖGLER, residente en HEINRICH-LANZ-STR. 3, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

12. EBERHARD AMMERMAN VON-GAGERN-STR. 2, 64646 HEPPENHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

13. SIEGFRIED STRATHMANN, DONNERSBERGSTR. 9, 67117 LIMBURGERHOF, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

14. ULRICH SCHÖFT, LUFTSCHIFFRING 22C, 68782 BRÜHL, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

15. REINHARD STIERL JAHNSTR. 8, 67251 FREINSHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío,

son verídicas y válidas

Ludwigshafen/Rhine, 17 de julio de 2003.

Firma ilegible

Sello realizado fijado sobre plástico blanco, con leyenda ilegible

E hilo que lo une al resto del documento.

APOSTILLA con número 91 Eb-732-737/03

28 de julio de 2003. Firmado: Werner Tholey

COLO-361-841-049-6

WPCL002G ID 6678

Bogotá, 20 de abril de 2005

Eduardo Calado N.

Eduardo Calado Noguera
"TRADUCTOR ESPECIAL"
BOLSA - BOMBA - BOMBA
Res. 541 Febrero de 1999

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

Eduardo Calado
107225
COTA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INMEDIATAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

1105
2005 APR 22 A 1:13
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE
Gerardo Ruiz
C. Gerardo Ruiz
COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTA FE DE BOGOTA. 21 ABR 2005

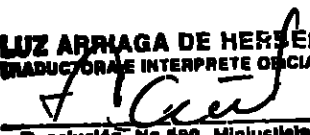


TRADUCCION OFICIAL No. 10659

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

Traducción de las legalizaciones en alemán que se encuentran a continuación de un documento de cesión, escrito en español e inglés, por medio del cual los señores

Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach
Alemania
Ciudadano de España
Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim.
Alemania
Ciudadano de Alemania
Bernd Müller Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal
Alemania
Ciudadano de Alemania
Markus Gewähr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Alemania
Ciudadano de Alemania
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Grecia
Thomas Grote
Im Hoehnhausen 18, 67157 Wachenheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Andreas Gypser
B 4 4, 68159 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Alemania

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Frank Schieweck Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Eberhard Ammermann
Von-Gagem-Str.2, 64646 Heppenheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Alemania
Ciudadano de Alemania
Ulrich Schöfl
Luftschifftring 22c, 68782 Brühl
Alemania
Ciudadano de Alemania
Reinhard Stierl
Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

declaran bajo juramento ser únicos y verdaderos inventores de la invención

5-alquil-7-aminotriazolopirimidinas, procedimientos y productos intermedios para su obtención, composiciones que las contienen y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos

y ceden sin limitación a la sociedad BASF AKTIENGESELLSCHAFT, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Dado y firmado el 17 de julio 2003 2004. Hay quince firmas ilegibles de los mencionados señores.

LUZ ARRIAGA DE HERRERA
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.598 Minjusticia

Autenticación notarial en inglés (individuo) de las quince firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 17 de julio de 2003.

(Firma ilegible del notario y sello redondo notarial, en tinta).

Nuevamente, autenticación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 17 de julio de 2003.

bajo el No. 1913/2003.- (Hilo y oblea notarial en relieve).

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por el notario Daxel (sic)-Fischer
3. Actuando en calidad de notario público
4. Lleva el sello del notario Draxel-Fischer, notario de Ludwigshafen am Rhein

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 28 de julio de 2003
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb – 732-737/03
9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma
Fdo.: firma ilegible
(Werner Tholey)

Costas:

Derechos 12,00 €

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

Bogotá, 19 de abril de 2005

C. 2834

LUZ ARRIAGA DE HERBES
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Luz Arriaga de Herbes
Resolución No. 599 Min. Justicia

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

107722F
Lea de Henao
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPLEA
LAS FUNCIONES DE NOTARIO

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 APR 22 A 1:14

2005
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE

Lea de Henao
de Henao

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA -
SANTAFE DE BOGOTA. **21 APR 2005**



22

D CUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2004/041825 /A1**

Descripción:

Páginas 1-31 en el idioma original

Páginas 1-32 en el idioma Inglés

Páginas 1-50 en español

Reivindicaciones: Número (s) 1-7

Figuras: Número (s) _____

2. ☐ **Forma PCT/RO/101. PCT Request**
3. ☐ **Forma PCT/RO/106. Invitation to Correct Defects.**
4. ☐ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**
5. ☐ **Forma PCT/ISA/220. Notificación De La Transmisión Del Informe De Búsqueda Internacional Y De La Opinión Escrita De La Administración Encargada De La Búsqueda Internacional, O De La Declaración.**
6. ☐ **Forma PCT/ISA/237. Opinión Escrita De La Administración Encargada De La Búsqueda Internacional.**
7. ☐ **Forma PCT/IB/304. Notification Concerning Submission Or Transmittal Of Priority Document.**
8. ☒ **Forma PCT/IB/306. Notification Of The Recoding Of A Change.**
Descripción De Modificación:
Cambio de nacionalidad de los Inventores: - Wasillios GRAMMENOS y Jordi TORMO I BLASCO
9. ☐ **Forma PCT/IB/308. Notice Informing The Applicant Of The Communication Of The International Application To The Designated Offices.**
10. ☐ **Forma PCT/IB/332. Information Concerning Elected Offices Notified Of Their Election.**
11. ☐ **Forma PCT/IPEA/401. PCT Demand**
12. ☐ **Forma PCT/IPEA/402. Notification Of Receipt Of Demand By Competent International Preliminary Examining Authority.**
13. ☐ **Forma PCT/IPEA/408. Written Opinion.**
14. ☐ **Forma PCT/IPEA/416. Notification Of Transmittal Of The International Preliminary Examination Report.**
15. ☒ **Forma PCT/IPEA/409. Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
16. ☐ **Traducción Al Español Del Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
17. ☐ **Traducción Al Español De Los Anexos Presentados Junto Con El Informe Del Examen Preliminar Internacional.**

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



54041 030311
[Barcode]

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:
21. Mai 2004 (21.05.2004)

PCT

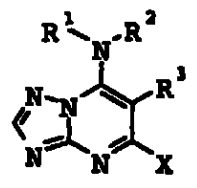
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/041825 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 487/04
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/012277
- (22) Internationales Anmeldedatum:
4. November 2003 (04.11.2003)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
102 52 261.8 7. November 2002 (07.11.2002) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von (A)): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Carl-Bosch-Strasse, 67056 Ludwigshafen (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO, Jordi [DE/DE]; Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach (DE). BLETNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr.21, 56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wasilios [DE/DE]; Alexander-Heming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hochhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). GYPSER, Andreas [DE/DE]; B 4
- 4, 68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr.1, 67308 Otterheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenbergweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). AMMERMAN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Str.2, 64646 Heppenheim (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Dannersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖPL, Ulrich [DE/DE]; Luftschiffring 22c, 68782 Brühl (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim (DE).
- (74) Gemeinamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; Carl-Bosch-Strasse 38, 67056 Ludwigshafen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GI, GM, GR, GU, HK, HU, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (BW, GI, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 5-ALKYL-7-AMINOTRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS AND INTERMEDIARY PRODUCTS NECESSARY FOR THE PRODUCTION THEREOF, AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS AND THE USE THEREOF FOR FIGHTING AGAINST HARMFUL MUSHROOMS

(54) Bezeichnung: 5-ALKYL-7-AMINOTRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN UND ZWISCHENPRODUKTE ZU IHRER HERSTELLUNG, SIE ENTHALTENDE MITTEL SOWIE IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN



(57) Abstract: The invention relates to 5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula (I) and to the salts thereof. In said formula substituents have the following meanings: R¹ and R² each is a hydrogen atom or a group of alkyl, alkenyl, alkenyl, haloalkyl, cycloalkyl, phenyl or naphthyl, saturated, unsaturated or aromatic heterocycle having from five to six members which contain from one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom, or R¹ and R² can form together with a connecting them nitrogen atom a cycle of 5 to 6 members containing from one to four nitrogen atoms or from one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom.

R¹ is a cycloalkyl or bicycloalkyl group. R¹, R² and R³ can be substituted in conformity with a description, and X is an alkyl or alkyl halide group. The inventive methods and intermediary products necessary for producing said compounds, agents containing them and the use thereof for fighting against harmful mushrooms are also disclosed.

(57) Zusammenfassung: 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel (I) in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben: R¹, R² Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkyl, Haloalkyl, Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; 5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder R¹ und R² können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält; R³ Cycloalkyl oder Bicycloalkyl; wobei R¹, R² und R³ gemäß der Beschreibung substituiert sein können; X Alkyl oder Halogenalkyl; sowie deren Salze; Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen.

WO 2004/041825 A1

M



ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IL, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NI, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchebericht

— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

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

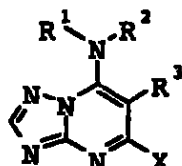
5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

5

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I,

10



I

15 in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

R¹, R² Wasserstoff, C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₁₀-Haloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; oder

20

5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

25

R¹ und R² können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält;

30

R¹ und R² können, wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen

35

R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Haloalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Alkynyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy-C₁-C₄-alkylenoxy;

40

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

45

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl,

2

Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können;

R³ C₃-C₁₄-Cycloalkyl oder C₆-C₁₄-Bicycloalkyl, wobei R³ unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen kann; und

X C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl;

sowie deren Salze.

Zusätzlich betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung der Verbindungen I, sowie Mittel und die Verwendung der Verbindungen I zur Bekämpfung von phytopathogenen Schädlingen.

6-Aryl-Triazolopyrimidine werden in WO 98/46608 und EP-A 550 113 offenbart. Durch aromatische Gruppen speziell substituierte 6-Benzyl-Triazolopyrimidine mit pharmazeutischer Wirkung sind aus US 5,231,094 und US 5,387,747 bekannt. EP-A 141 317 offenbart 6-Aryl- und 6-Arylalkyl-7-aminotriazolopyrimidine, welche in 5-Position einen Alkylrest tragen können. 6-Cycloalkyltriazolopyrimidine mit diversen Resten in 5-Position werden in EP-A 613 900

genannt. 5-Alkyl-6-phenyl-7-aminotriazolopyrimidine sind aus US 5,994,360 bekannt.

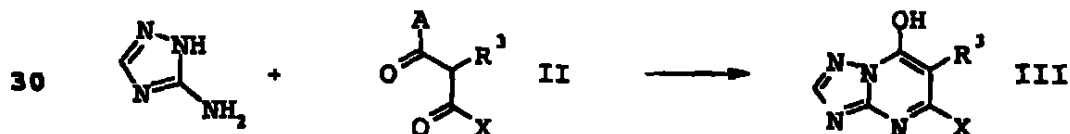
Die in WO 98/46608, EP-A 550 113, EP-A 141 317, EP-A 613 900 und 5 US 5,994,360 beschriebenen Verbindungen sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schadpilze geeignet.

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter .
10 Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I gefunden. Weiterhin wurden Zwischenprodukte und Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I, sowie die Verwendung der Verbindungen I und diese enthaltende Mittel zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften bekannten Verbindungen durch die Kombination der 5-Alkylgruppe mit der als mono- oder bicyclisches Cycloalkyl ausgestalteten Gruppe R³ am Triazolopyrimidingerüst.
20

7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I, sind vorteilhaft erhältlich durch Umsetzung von 3-Amino-1,2,4-triazol mit Dicarboxylverbindungen der Formel II, wobei A für C₁-C₁₀-Alkoxy, insbesondere für C₁-C₄-Alkyl steht und R³ und X wie für Formel I definiert sind, zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel III:
25



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 210°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A-770 615].
35

Als Basen kommen allgemein organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin in Betracht. Besonders bevorzugt werden Triethylamin und Tributylamin.
40

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

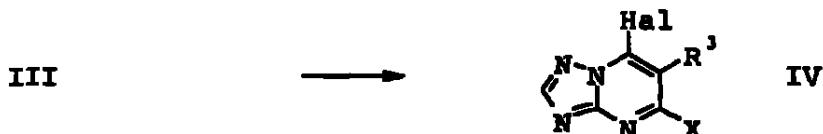
Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, II in einem Überschuß bezogen auf das Aminotriazol einzusetzen.

5 Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe sind in der Literatur bekannt oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden [Heterocycl. 1996, S.1031; Tetrahedron Lett. 1966, Bd.24, S.2661; Chem. Pharm. Bull. 1961, S.801] oder sind kommerziell zugänglich.

10

Anschließend setzt man die 7-Hydroxytriazolopyrimidine der Formel III mit einem Halogenierungsmittel zu 7-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV um:

15



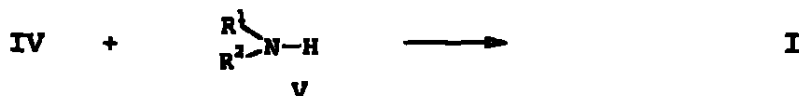
Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise 80°C bis 125°C, in einem inerten organischen

20 Lösungsmittel oder ohne Lösungsmittel [vgl. EP-A-770 615].

Als Halogenierungsmittel kommen bevorzugt Bromierungs- oder Chlorierungsmittel, wie beispielsweise Phosphoroxobromid oder Phosphoroxochlorid, in Substanz oder in Anwesenheit eines Lösungsmittels in Frage.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, besonders bevorzugt 30 Toluol, o-, m- und p-Xylol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Die Halogentriazolopyrimidine der Formel IV werden mit einem Amin der Formel V zu 7-Aminotriazolopyrimidinen der Formel I umgesetzt.



40 Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 70°C, vorzugsweise 10°C bis 35°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 550 113].

Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie 45 Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethyl-

5

ether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali-
5 metall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalka-
limetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride,
Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie
Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkali-
metallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorga-
10 nische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagne-
siumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate
und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre
Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und
N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine sowie bicycli-
15 sche Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Triethylamin,
Kaliumcarbonat und Natriumcarbonat.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen einge-
setzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebe-
20 nenfalls als Lösungsmittel verwendet werden. Alternativ dazu kann
ein Überschuß der Verbindung V als Base dienen.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander
umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, V in
25 einem Überschuß bezogen auf IV einzusetzen.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet,
z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenen-
falls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen-
30 und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräun-
licher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig
erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gerei-
nigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe
erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren
35 oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend be-
schriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisie-
rung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

40

7-Hydroxy- und 7-Halogentriazolopyrimidine der Formeln III und
IV, wobei X und R³ die Bedeutung wie in Formel I hat und Hal Halo-
gen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet, sind neu.

45

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

5 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 10 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Di- 15 methylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 20 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise, beispielsweise ein- bis dreifach, oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluor- 25 methyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 35 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 40 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 45 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl,

7

4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und
 10 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkinyl wie Ethinyl,
 15 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl,
 20 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl,
 25 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 5, 6, oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl,
 30 Cycloheptyl und Cyclooctyl;

Bicycloalkyl: bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 6 bis 14, insbesondere 7 oder 10 Kohlenstoffringgliedern, bestehend aus annelierten 5-, 6- und/oder 7-gliederigen Ringsystemen.
 35

5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl (gesättigtes Heterocyclyl), enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isioxazolidinyl, 4-Isioxazolidinyl, 5-Isioxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazo-
 40
 45

lidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;

5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl (ungesättigtes Heterocyclyl), enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome und eine oder zwei C=C-Doppelbindungen, z.B. 3,6-Dihydro-2H-pyridin-1-yl oder 2,5-Dihydropyrrol-1-yl;

5-gliedriges Heteroaryl (aromatisches Heterocyclyl), enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;

6-gliedriges Heteroaryl (aromatisches Heterocyclyl), enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;

Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O;

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es in der Regel nicht auf die Art des Salzes ankommt. Im Allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vor-

9

zugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein
5 können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren, Phosphoniumionen, Sulfonium-
10 ionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxonium-
ionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat,
15 Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Sofern R¹ und/oder R² ein Chiralitätszentrum aufweist, sind die
20 (R)- und (S)-Isomere und die Razemate der Verbindungen der Formel I in den Umfang der Erfindung eingeschlossen.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste R³ und X
25 der Formel I.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein
30 oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R¹ und R² für Wasserstoff, C₁-C₁₀-Alkyl oder C₁-C₆-Haloalkyl, insbesondere für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl, besonders bevorzugt für Wasserstoff,
35 1-Methylpropyl, Isopropyl oder 1,1,1-Trifluor-2-propyl steht.

Bevorzugt sind auch Verbindungen I, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann, wie Pyrrolidin-1-yl, Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, Piperidin-1-yl, Morpholin-4-yl, Thiomorpholin-4-yl, 3,6-Dihydro-2H-pyridin-1-yl, 2,5-Dihydropyrrol-1-yl, wobei die genannten Reste durch eine bis drei Gruppen R³, insbesondere durch C₁-C₄-Alkyl, wie beispielsweise Methyl oder Ethyl, substituiert
45 sein können. Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ und R² gemeinsam eine 4-Methylpiperidin-1-yl-Gruppe bilden.

10

Insbesondere bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R¹ nicht Wasserstoff bedeutet.

Daneben werden auch Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen
5 R¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Haloalkyl und R² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Wasserstoff, bedeutet.

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ und R²
keine Gruppen R^b tragen, insbesondere solche, in denen R¹ und R²
10 keine Gruppen R^a tragen.

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand sind Verbindungen I, in denen
R¹ und R² Wasserstoff bedeuten.

15 Besonders werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R³
C₃-C₁₂-Cycloalkyl, bevorzugt Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl,
Cyclooctyl oder Cyclododecyl oder Bicycloheptyl bedeuten, wobei R³
ggf. eine bis drei Gruppen R^a tragen kann. Insbesondere ist R³
unsubstituiert.

20

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X
für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Methyl steht.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den fol-
25 genden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die
in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen
außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in
der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des
betreffenden Substituenten dar.

30

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopropyl, X für Me-
thyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Ver-
bindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopropyl, X für
Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Ver-
bindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopropyl, X für
n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine
Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopropyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopentyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopentyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopentyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclopentyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cycloheptyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 14

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cycloheptyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 15

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cycloheptyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 16

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cycloheptyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclooctyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 18

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclooctyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 19

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclooctyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 20

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclooctyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 21

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclododecyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

13

Tabelle 22

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclododecetyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 23

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclododecetyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 24

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Cyclododecetyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

35 spricht

Tabelle 29

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclopentyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für

40 eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 30

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclopentyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine

45 Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 31

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclopentyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 32

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclopentyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 33

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclopentyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 34

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclopentyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 35

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclopentyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 36

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclopentyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 37

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 38

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 39

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

15

Tabelle 40

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 2-Methylcyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 41

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 42

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 43

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 44

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 3-Methylcyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 45

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 46

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 47

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

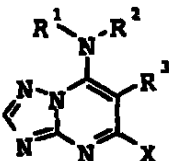
Tabelle 48

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle A

5



I

No.	R ¹	R ²
A-1	H	H
10	A-2	CH ₂ CH ₃
	A-3	CH ₂ CH ₃
	A-4	CH ₂ CH ₃
15	A-5	CH ₂ CF ₃
	A-6	CH ₂ CF ₃
	A-7	CH ₂ CF ₃
20	A-8	CH ₂ CCl ₃
	A-9	CH ₂ CCl ₃
	A-10	CH ₂ CCl ₃
25	A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃
30	A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃
	A-15	CH(CH ₃) ₂
	A-16	CH(CH ₃) ₂
35	A-17	CH(CH ₃) ₂
	A-18	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
	A-19	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
40	A-20	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
	A-21	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
	A-22	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
45	A-23	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
	A-24	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
	A-25	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
50	A-26	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃
	A-27	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-28	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
55	A-29	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-30	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-31	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
60	A-32	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-33	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-34	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
65	A-35	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-36	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃
	A-37	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃
70	A-38	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃

No.	R ¹	R ²
A-39	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
5 A-42	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
10 A-46	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-47	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-48	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
15 A-51	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-55	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
20 A-56	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
25 A-61	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-64	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
30 A-65	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-66	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-67	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-68	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
35 A-70	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-71	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-72	cyclopentyl	H
A-73	cyclopentyl	CH ₃
A-74	cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
40 A-75	cyclohexyl	H
A-76	cyclohexyl	CH ₃
A-77	cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-78	-(CH ₂) ₄ -	
45 A-79	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-80	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-81	-(CH ₂) ₅ -	

No.	R ¹	R ²
A-82	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-83	-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -	
A-84	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-85	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-86	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-87	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-88	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-89	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-90	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-91	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

- Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:
- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
 - *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
 - *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
 - *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
 - *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
 - *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
 - *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
 - *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
 - *Plasmopara viticola* an Reben,
 - *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
 - *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
 - *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
 - *Puccinia*-Arten an Getreide,
 - *Pyricularia oryzae* an Reis,
 - *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
 - *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
 - *Uncinula necator* an Reben,

- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

15

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

45

20

Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP),
5 Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Ton-
10 erden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methyl-
15 cellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylaryl-
20 sulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Form-
25 aldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkyl-arylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether,
30 ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpoly-glykoletheracetat, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen,
35 Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naph-
40 thaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

21

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- 5 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogen-
granulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Träger-
stoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineral-
erden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalk-
stein, Kalk, Kreide, Bolus, Löss, Ton, Dolomit, Diatomeenerde,
10 Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunst-
stoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat,
Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie
Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulose-
pulver und andere feste Trägerstoffe.

15

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95
Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs.
Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%,
vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

20

Beispiele für Formulierungen sind:

1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

25 A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Al-
ternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt.
Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

30

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Poly-
vinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich
35 eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinus-
40 ölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in
Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinus-
45 ölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels
einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und

22

zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

- E Suspensionen (SC, OD)
5 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.
10
- F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)
50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und
15 mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.
- 20 G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)
75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des
25 Wirkstoffs.
2. Produkte für die Direktapplikation
- H Stäube (DP)
30 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.
- I Granulate (GR, FG, GG, MG)
35 0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.
40
- J ULV- Lösungen (UL)
10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.
45

23

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

10

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- 5 · Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
 - Ainderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
 - Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- 10 · Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
 - Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 15 · Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
 - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbat, Thiram, Ziram, Zineb,
 - Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Siltiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- 25 · Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
 - Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
 - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
 - Schwefel
- 30 · Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomazin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozens, Zoxamid
- 40 · Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 45 · Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid

25

Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Plumorph.

Synthesebeispiele

5

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit 10 physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1 Herstellung von 2-Cyclopentyl-3-oxobutylsäureethylester

15 Eine Mischung von 3-Oxobutylsäure ethylester (0,5 mol), Cyclopentylbromid (0,5 mol) und Natriumethoxylat (0,5 mol) in Ethanol (100 ml) wurde 15 Std. refluxiert. Nach Abkühlen der Reaktionsmischung auf etwa 20 bis 25°C wurden 71g der Titelverbindung durch Destillation (96-100°C, 0,25 mbar) isoliert.

20

Beispiel 2 Herstellung von 5-Methyl-6-cyclopentyl-7-hydroxy-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

Eine Mischung von 3-Amino-1,2,4-triazol (14 g), 2-Cyclopentyl-3-oxobutylsäureethylester (0,17 mol, Bsp. 1) und Tributylamin 25 (50 ml) wurde für 6 Std. auf 180°C erhitzt. Nach Abkühlen der Reaktionsmischung auf etwa 70°C wurde wässr. NaOH-Lösung (21g in 200 ml H₂O) zugesetzt und die Lösung weitere 30 min gerührt. Nach Phasentrennung und Extraktion mit Diethylether wurde die wässrige 30 Phase mit konz. HCl-Lösung angesäuert. Aus dem Niederschlag erhielt man 19g der Titelverbindung.

Beispiel 3 Herstellung von 5-Methyl-6-cyclopentyl-7-chlor-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

35

Eine Mischung von 5-Methyl-6-cyclopentyl-7-hydroxy-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pyrimidin (17 g, Bsp. 2) und POCl₃ (50 ml) wurde 8 Std. refluxiert. Dabei destillierte ein Teil des POCl₃ ab. Der Rückstand wurde in ein Dichlormethan/Wasser-Gemisch gegeben. Die 40 organische Phase wurde abgetrennt und getrocknet. Nach Abtrennen des Lösungsmittels erhielt man 11g der Titelverbindung vom Fp. 87°C.

45

Beispiel 4 Herstellung von 5-Methyl-6-cyclopentyl-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-1]

5 Eine Lösung von 4-Methylpiperidin (1,5 mmol) und Triethylamin (1,5 mmol) 10 ml Dichlormethan wurde unter Rühren zu einer Lösung von 5-Methyl-6-cyclopentyl-7-chlor-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin (1,5 mmol, Bsp. 3) in 20ml Dichlormethan gegeben. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt, dann mit
10 5%iger HCl-Lösung gewaschen. Die organische Phase wurde abgetrennt und getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel wurden daraus 0,26g der Titelverbindung vom Fp. 145°C erhalten.

15 Tabelle I: Verbindungen der Formel I

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	phys. Daten (Fp. [°C]; IR [cm ⁻¹])
20	I-1	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cyclopentyl	CH ₃	145
	I-2	^(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cyclopentyl	CH ₃	96
	I-3	^(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cyclopentyl	CH ₃	108
25	I-4	H	H	Cyclopentyl	CH ₃	271
	I-5	CH ₃	H	Cyclopentyl	CH ₃	175
	I-6	^(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cyclopentyl	CH ₃	1960; 1605; 1590; 1240

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

30

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt als Stammlösung formuliert mit
35 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt. Die Stammlösungen der Wirkstoffe wurden entsprechend der angegebenen Konzentration mit Wasser verdünnt.

40

Beispiel 1: Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani*

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St.
45 Pierre" wurden mit einer wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenauf-

schwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^6$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm des Wirkstoffs I-1 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90% befallen war.

Beispiel 2: Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

15

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die $1,7 \times 10^6$ Sporen/ml in einer 2 %-igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-1, bzw. I-3 behandelten Pflanzen maximal 20% Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90% befallen waren.

30

Beispiel 3 - Wirksamkeit gegen Mehltau an Gurkenblättern verursacht durch *Sphaerotheca fuliginea* bei protektiver Anwendung

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (*Sphaerotheca fuliginea*) inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luftfeuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermittelt.

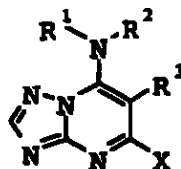
In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-1, bzw. I-3 behandelten Pflanzen nicht über 3% Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90% befallen waren.

45

Patentansprüche

1. 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I,

5



I

10 in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

R^1, R^2 Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkiny-
 15 nyl, C_1 - C_{10} -Haloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, Phenyl, Naph-
 thyl; oder

15

5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder
 aromatisches Heterocycl, enthaltend ein bis vier
 Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und
 ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

20

R^1 und R^2 können zusammen mit dem Stickstoffatom, das
 sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden,
 der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei
 Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom
 25 enthält;

25

R^1 und R^2 können, wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig
 voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein
 und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen

30

R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halo-
 alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloal-
 koxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di-
 C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy,
 35 C_2 - C_6 -Alkiny, C_3 - C_8 -Alkinyloxy und gegebenenfalls
 halogeniertes Oxy- C_1 - C_4 -alkylenoxy;

35

wobei diese aliphatischen oder alicyclischen Grup-
 pen ihrerseits partiell oder vollständig haloge-
 niert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen
 40 können:

40

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto,
 Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocar-
 45 bonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy,
 Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio,
 Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbo-

45

29

- nyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können;
- R³ C₃-C₁₄-Cycloalkyl oder C₆-C₁₄-Bicycloalkyl, wobei R³ unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen kann; und
- X C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl;
- sowie deren Salze.
2. 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1, in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:
- R¹, R² Wasserstoff, C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₁₀-Haloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; oder
- 5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder
- R¹ und R² können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei

30

Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält;

5 R^1 und R^2 können, wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen

10 R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di-
 C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Alkinyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy- C_1 - C_4 -alkylenoxy;

15 R^3 C_3 - C_{14} -Cycloalkyl oder C_6 - C_{14} -Bicycloalkyl, wobei R^3 unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen kann; und

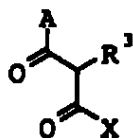
20 X C_1 - C_6 -Alkyl;

sowie deren Salze.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X
 25 für Methyl steht.

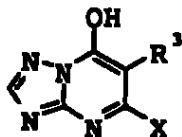
4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man Dicarbonylverbindungen der Formel II

30



II

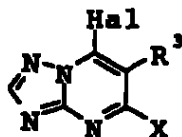
35 wobei A für C_1 - C_{10} -Alkoxy und R^3 und X wie für Formel I definiert ist, mit 3-Amino-1,2,4-triazol zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel III



III

40

cyclisiert und III mit einem Halogenierungsmittel zu 7-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV



IV

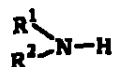
45

4x

31

halogeniert, wobei Hal für Halogen steht, und anschließend mit einem Amin der Formel V

5



V

worin R¹ und R² wie in Formel I definiert sind, zu 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidinen der Formel I umsetzt.

- 10 5. Verbindungen der Formeln III und IV wie in Anspruch 4 definiert.
6. Zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff
- 15 und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.
7. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 in einer Menge von 0,001 bis 1 g/kg.
- 20 8. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.
9. Verfahren zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbe-
- 25 fall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Internat. No.
PCT/EP 03/12277

75

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/083677 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 24 October 2002 (2002-10-24) Seite 1, Formel I page 10, line 18 - page 11, line 12	1-9
A	EP 0 141 317 A (BASF AG) 15 May 1985 (1985-05-15) cited in the application Seite 1, Formel I Seite 9, Tabelle, Verb. Nr. 9 page 10, line 34 - page 11, line 2	1-9

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
E earlier document but published on or after the international filing date
L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 March 2004

Date of mailing of the international search report

24/03/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5816 Patentstein 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hoepfner, W

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP 03/12277

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 02083677 A	24-10-2002	WO 02083677 A1 EP 1381610 A1	24-10-2002 21-01-2004
EP 0141317 A	15-05-1985	DE 3338292 A1 AT 32077 T AU 566960 B2 AU 3452684 A CA 1242715 A1 CS 248724 B2 DD 232635 A5 DE 3468878 D1 EP 0141317 A2 HU 36328 A2 IL 73258 A JP 60104089 A NZ 209936 A PL 250093 A2 US RE32676 E US 4617303 A	02-05-1985 15-02-1988 05-11-1987 26-04-1985 04-10-1988 12-02-1987 05-02-1986 25-02-1988 15-05-1985 30-09-1985 30-11-1987 08-06-1985 31-03-1987 16-07-1985 24-05-1988 14-10-1986

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04

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

B. RESEARCHIERTE GEBIETEResearchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, MPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 02/083677 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) Seite 1, Formel I Seite 10, Zeile 18 - Seite 11, Zeile 12	1-9
A	EP 0 141 317 A (BASF AG) 15. Mai 1985 (1985-05-15) In der Anmeldung erwähnt Seite 1, Formel I Seite 9, Tabelle, Verb. Nr. 9 Seite 10, Zeile 34 - Seite 11, Zeile 2	1-9

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteste Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

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

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

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

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung: die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

16. März 2004

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts

24/03/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentamt 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Hoepfner, W

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internat	Ionzeichen
PCT/EP 03/12277	

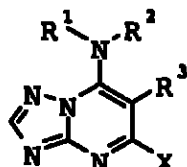
Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 02083677	A	24-10-2002	WO	02083677 A1	24-10-2002
			EP	1381610 A1	21-01-2004
EP 0141317	A	15-05-1985	DE	3338292 A1	02-05-1985
			AT	32077 T	15-02-1988
			AU	566960 B2	05-11-1987
			AU	3452684 A	26-04-1985
			CA	1242715 A1	04-10-1988
			CS	248724 B2	12-02-1987
			DD	232635 A5	05-02-1986
			DE	3468878 D1	25-02-1988
			EP	0141317 A2	15-05-1985
			HU	36328 A2	30-09-1985
			IL	73258 A	30-11-1987
			JP	60104089 A	08-06-1985
			NZ	209936 A	31-03-1987
			PL	250093 A2	16-07-1985
			US	RE32676 E	24-05-1988
			US	4617303 A	14-10-1986

5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes and intermediates for their preparation, compositions comprising them and their use for controlling harmful fungi

5

The present invention relates to
5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I,

10



I

15 where:

R¹, R² are hydrogen, C₁-C₁₀-alkyl, C₂-C₁₀-alkenyl, C₂-C₁₀-alkynyl, C₁-C₁₀-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, phenyl, naphthyl; or

20

5- or 6-membered saturated, unsaturated or aromatic heterocyclyl which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; or

25

R¹ and R² together with the bridging nitrogen atom can form a 5- or 6-membered ring which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom;

30

if R¹ and R² are not hydrogen they can, independently of one another, be partially or fully halogenated and/or may carry one to three radicals from the group R^a

35

R^a is cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-alkynyloxy and unhalogenated or halogenated oxy-C₁-C₄-alkyleneoxy;

40

where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups R^b:

45

R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy,

2

alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy, alkoxy carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals contain 1 to 6 carbon atoms and the alkenyl or alkynyl groups mentioned in these radicals contain 2 to 8 carbon atoms;

10

and/or one to three of the following radicals:

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocycliloxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C₁-C₆-alkoxy, aryl-C₁-C₆-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to 10 ring members, the hetaryl radicals contain 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or may be substituted by alkyl or haloalkyl groups;

R³ is C₃-C₁₄-cycloalkyl or C₆-C₁₄-bicycloalkyl, where R³ may be unsubstituted or partially or fully halogenated and/or may carry one to three radicals from the group R^a; and

X is C₁-C₆-alkyl or C₁-C₂-haloalkyl;

and their salts.

Additionally, the invention relates to processes and intermediates for preparing the compounds I, and to compositions and to the use of the compounds I for controlling phytopathogenic harmful fungi.

6-Aryltriazolopyrimidines are disclosed in WO 98/46608 and EP-A 550 113. 6-Benzyltriazolopyrimidines which are substituted in a specific manner by aromatic groups and have pharmaceutical action are known from US 5,231,094 and US 5,387,747. EP-A 141 317 discloses 6-aryl- and 6-arylalkyl-7-aminotriazolopyrimidines which may carry an alkyl radical in the 5-position.

6-Cycloalkyltriazolopyrimidines having various radicals in the 5-position are mentioned in EP-A 613 900.

5-Alkyl-6-phenyl-7-aminotriazolopyrimidines are known from US 5,994,360.

3

The compounds described in WO 98/46608, EP-A 550 113, EP-A 141 317, EP-A 613 900 and US 5,994,360 are suitable for use as crop treatment agents against harmful fungi.

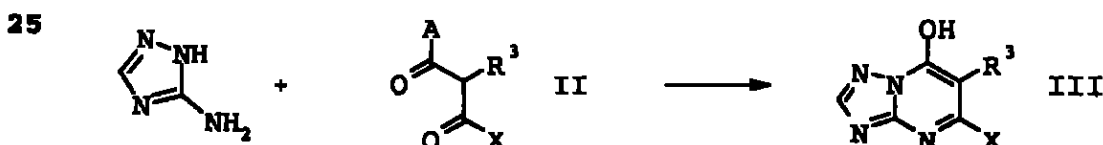
5 However, in many cases their action is unsatisfactory. It is an object of the present invention to provide compounds having improved activity.

This object has been achieved by the

10 5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I. Furthermore, we have found intermediates and processes for preparing the compounds I, and the use of the compounds I and of compositions comprising them for controlling phytopathogenic harmful fungi.

15 The compounds of the formula I differ from the compounds known from the publications mentioned above by the combination of the 5-alkyl group with the mono- or bicyclic cycloalkyl group R³ on the triazolopyrimidine skeleton.

20 7-Aminotriazolopyrimidines of the formula I can be obtained advantageously by reacting 3-amino-1,2,4-triazole with dicarbonyl compounds of the formula II where A is C₁-C₁₀-alkoxy, in particular C₁-C₄-alkoxyl, and R³ and X are as defined for formula I, to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula III:



This reaction is usually carried out at temperatures of from 25°C
30 to 210°C, preferably from 120°C to 180°C, in the presence of a base [cf. EP-A-770 615].

Suitable bases are, in general, organic bases, for example tertiary amines such as trimethylamine, triethylamine,
35 triisopropylamine, tributylamine and N-methylpiperidine and pyridine. Particular preference is given to triethylamine and tributylamine.

In general, the bases are employed in catalytic amounts; however,
40 they can also be employed in equimolar amounts, in excess or, if appropriate, as solvent.

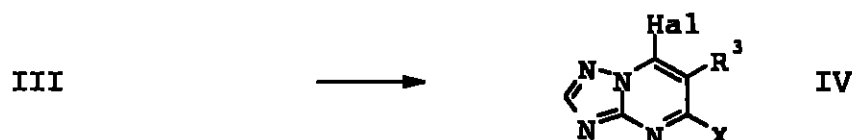
The starting materials are generally reacted with one another in equimolar amounts. In terms of yield, it may be advantageous to
45 employ an excess of II, based on the aminotriazole.

4

The starting materials required for preparing the compounds I are known from the literature or can be prepared in accordance with the literature cited [Heterocycl. 1996, 1031; Tetrahedron Lett. 24 (1966), 2661; Chem. Pharm. Bull. 1961, 801], or they are
5 commercially available.

The 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula III are then reacted with a halogenating agent to give
7-halotriazolopyrimidines of the formula IV:

10

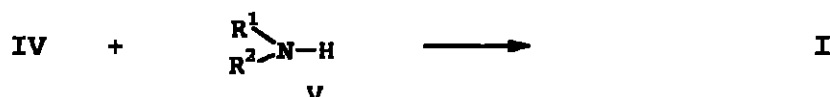


This reaction is usually carried out at temperatures of from 0°C
15 to 150°C, preferably from 80°C to 125°C, in an inert organic solvent or in the absence of a solvent [cf. EP-A-770 615].

Preferred halogenating agents are brominating or chlorinating agents, such as, for example, phosphorus oxybromide or phosphorus
20 oxychloride, neat or in the presence of a solvent.

Suitable solvents are aliphatic hydrocarbons, such as pentane, hexane, cyclohexane and petroleum ether, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, particularly preferably
25 toluene, o-, m- and p-xylene. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned.

The halotriazolopyrimidines of the formula IV are reacted with an amine of the formula V to give 7-aminotriazolopyrimidines of the
30 formula I.



35 This reaction is usually carried out at temperatures of from 0°C to 70°C, preferably from 10°C to 35°C, in an inert organic solvent in the presence of a base [cf. EP-A 550 113].

Suitable solvents are aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-,
40 m- and p-xylene, halogenated hydrocarbons, such as methylene chloride, chloroform and chlorobenzene, ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, tert-butyl methyl ether, dioxane, anisole and tetrahydrofuran.

45 Suitable bases are, in general, inorganic compounds, such as alkali metal and alkaline earth metal hydroxides, alkali metal and alkaline earth metal oxides, alkali metal and alkaline earth

5

metal hydrides, alkali metal amides, alkali metal and alkaline earth metal carbonates, such as lithium carbonate, potassium carbonate and calcium carbonate, and also alkali metal bicarbonates, such as sodium bicarbonate, organometallic compounds, in particular alkali metal alkyls, alkylmagnesium halides and also alkali metal and alkaline earth metal alkoxides and dimethoxymagnesium, moreover organic bases, for example tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, triisopropylamine and N-methylpiperidine, pyridine, substituted pyridines and also bicyclic amines. Particular preference is given to triethylamine, potassium carbonate and sodium carbonate.

The bases are generally employed in catalytic amounts; however, they can also be used in equimolar amounts, in excess or, if appropriate, as solvent. Alternatively, an excess of the compound V may serve as base.

The starting materials are generally reacted with one another in equimolar amounts. In terms of yield, it may be advantageous to employ an excess of V, based on IV.

The reaction mixtures are worked up in a customary manner, for example by mixing with water, separating the phases and, if appropriate, chromatographic purification of the crude products. In some cases, the intermediates and end products are obtained in the form of colorless or slightly brownish viscous oils which can be freed from volatile components or purified under reduced pressure and at moderately elevated temperatures. If the intermediates and end products are obtained as solids, purification can also be carried out by recrystallization or digestion.

If individual compounds I are not obtainable by the routes described above, they can be prepared by derivatization of other compounds I.

7-Hydroxy- and 7-halotriazolopyrimidines of the formulae III and IV, respectively, where X and R³ are as defined in formula I and Hal is halogen, in particular chlorine or bromine, are novel.

In the definitions of the symbols given in the formulae above, collective terms were used which, in a general manner, represent the following substituents:

halogen: fluorine, chlorine, bromine and iodine;

6

alkyl: saturated, straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 1 to 4, 6, 8 or 10 carbon atoms, for example C₁-C₆-alkyl, such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, 5 hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 10 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl;

haloalkyl: straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 10 carbon atoms (as mentioned above), where some, for example one to 15 three, or all of the hydrogen atoms in these groups may be replaced by halogen atoms as mentioned above, for example C₁-C₂-haloalkyl, such as chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 20 methyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl and pentafluoroethyl;

alkenyl: unsaturated, straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 6 or 10 carbon atoms and a double bond in any position, for example C₂-C₆-alkenyl, such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methylethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl,

7

2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl,
 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl,
 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl,
 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl,
 5 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and
 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;

alkynyl: straight-chain or branched hydrocarbon groups having 2
 to 6 or 10 carbon atoms and a triple bond in any position, for
 10 example C₂-C₆-alkynyl, such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl,
 1-butyne, 2-butyne, 3-butyne, 1-methyl-2-propynyl, 1-pentyne,
 2-pentyne, 3-pentyne, 4-pentyne, 1-methyl-2-butyne,
 1-methyl-3-butyne, 2-methyl-3-butyne, 3-methyl-1-butyne,
 1,1-dimethyl-2-propynyl, 1-ethyl-2-propynyl, 1-hexynyl,
 15 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-methyl-2-pentyne,
 1-methyl-3-pentyne, 1-methyl-4-pentyne, 2-methyl-3-pentyne,
 2-methyl-4-pentyne, 3-methyl-1-pentyne, 3-methyl-4-pentyne,
 4-methyl-1-pentyne, 4-methyl-2-pentyne, 1,1-dimethyl-2-butyne,
 1,1-dimethyl-3-butyne, 1,2-dimethyl-3-butyne,
 20 2,2-dimethyl-3-butyne, 3,3-dimethyl-1-butyne,
 1-ethyl-2-butyne, 1-ethyl-3-butyne, 2-ethyl-3-butyne and
 1-ethyl-1-methyl-2-propynyl;

cycloalkyl: monocyclic, saturated hydrocarbon groups having 3 to
 25 5, 6 or 8 carbon ring members, for example C₃-C₈-cycloalkyl, such
 as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl
 and cyclooctyl;

bicycloalkyl: bicyclic, saturated hydrocarbon groups having 6 to
 30 14, in particular 7 or 10, carbon ring members, which groups
 consist of fused 5-, 6- and/or 7-membered ring systems.

5- or 6-membered heterocyclyl (saturated heterocyclyl) which
 comprises one to three nitrogen atoms and/or one oxygen or sulfur
 35 atom or one or two oxygen and/or sulfur atoms, for example
 2-tetrahydrofuranyl, 3-tetrahydrofuranyl, 2-tetrahydrothienyl,
 3-tetrahydrothienyl, 2-pyrrolidinyl, 3-pyrrolidinyl,
 3-isoxazolidinyl, 4-isoxazolidinyl, 5-isoxazolidinyl,
 3-isothiazolidinyl, 4-isothiazolidinyl, 5-isothiazolidinyl,
 40 3-pyrazolidinyl, 4-pyrazolidinyl, 5-pyrazolidinyl,
 2-oxazolidinyl, 4-oxazolidinyl, 5-oxazolidinyl, 2-thiazolidinyl,
 4-thiazolidinyl, 5-thiazolidinyl, 2-imidazolidinyl,
 4-imidazolidinyl, 2-pyrrolin-2-yl, 2-pyrrolin-3-yl,
 3-pyrrolin-2-yl, 3-pyrrolin-3-yl, 2-piperidinyl, 3-piperidinyl,
 45 4-piperidinyl, 1,3-dioxan-5-yl, 2-tetrahydropyranyl,
 4-tetrahydropyranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-hexahydropyridazinyl,

8

4-hexahydropyridazinyl, 2-hexahydropyrimidinyl, 4-hexahydropyrimidinyl, 5-hexahydropyrimidinyl and 2-piperazinyl;

5- or 6-membered heterocyclyl (unsaturated heterocyclyl) which comprises one to three nitrogen atoms and/or one oxygen or sulfur atom or one or two oxygen and/or sulfur atoms and one or two C=C double bonds, for example 3,6-dihydro-2H-pyridin-1-yl or 2,5-dihydropyrrol-1-yl;

10 5-membered heteroaryl (aromatic heterocyclyl) which comprises one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom: 5-membered heteroaryl groups which, in addition to carbon atoms, may comprise one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom as
15 ring members, for example 2-furyl, 3-furyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 3-pyrazolyl, 4-pyrazolyl, 5-pyrazolyl, 2-oxazolyl, 4-oxazolyl, 5-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-thiazolyl, 5-thiazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl and 1,3,4-triazol-2-yl;

20 6-membered heteroaryl (aromatic heterocyclyl) which comprises one to three or one to four nitrogen atoms: 6-membered heteroaryl groups which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three or one to four nitrogen atoms as ring members, for example 2-pyridinyl, 3-pyridinyl, 4-pyridinyl, 3-pyridazinyl,
25 4-pyridazinyl, 2-pyrimidinyl, 4-pyrimidinyl, 5-pyrimidinyl and 2-pyrazinyl;

oxyalkyleneoxy: divalent unbranched chains of 1 to 3 CH₂ groups, where both valences are attached to the skeleton via an oxygen
30 atom, for example OCH₂O, OCH₂CH₂O and OCH₂CH₂CH₂O.

The compounds of the formula I can also be present in the form of their agriculturally useful salts, where the type of salt is generally not important. Suitable salts are, in general, the
35 salts of those cations or the acid addition salts of those acids whose cations and anions, respectively, have no adverse effect on the fungicidal action of the compounds I.

Suitable cations are in particular ions of the alkali metals, preferably lithium, sodium and potassium, of the alkaline earth
40 metals, preferably calcium and magnesium, and of the transition metals, preferably manganese, copper, zinc and iron, and also ammonium, where, if desired, one to four hydrogen atoms may be replaced by C₁-C₄-alkyl, hydroxy-C₁-C₄-alkyl,
45 C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, phenyl or benzyl. Preference is given to ammonium, dimethylammonium, diisopropylammonium, tetramethylammonium, tetrabutylammonium,

9

2-(2-hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium,
di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, trimethylbenzylammonium,
furthermore phosphonium ions, sulfonium ions, preferably
tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium, and sulfoxonium ions, preferably
5 tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium.

Anions of useful acid addition salts are primarily chloride,
bromide, fluoride, hydrogensulfate, sulfate, dihydrogenphosphate,
hydrogenphosphate, nitrate, hydrogencarbonate, carbonate,
10 hexafluorosilicate, hexafluorophosphate, benzoate, and the anions
of C₁-C₄-alkanoic acids, preferably formate, acetate, propionate
and butyrate.

If R¹ and/or R² have/has a center of chirality, the (R)- and
15 (S)-isomers and the racemates of the compounds of the formula I
are included in the scope of the invention.

With respect to the variables, the particularly preferred
embodiments of the intermediates correspond to those of radicals
20 R³ and X in formula I.

With a view to the intended use of the 5-alkyl-7-aminotriazolo-
pyrimidines of the formula I, particular preference is given to
the following meanings of the substituents, in each case on their
25 own or in combination:

Preference is given to compounds I in which R¹ and R² are
hydrogen, C₁-C₁₀-alkyl or C₁-C₆-haloalkyl, in particular hydrogen,
C₁-C₆-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl and with particular preference
30 hydrogen, 1-methylpropyl, isopropyl or 1,1,1-trifluoro-2-propyl.

Preference is also given to compounds I in which R¹ and R²
together with the bridging nitrogen atom form a 5- or 6-membered
ring which may contain an oxygen or sulfur atom, such as
35 pyrrolidin-1-yl, pyrrol-1-yl, pyrazol-1-yl, imidazol-1-yl,
piperidin-1-yl, morpholin-4-yl, thiomorpholin-4-yl,
3,6-dihydro-2H-pyridin-1-yl, 2,5-dihydropyrrol-1-yl, where the
radicals mentioned may be substituted by one to three groups R^a,
in particular by C₁-C₄-alkyl, such as, for example, methyl or
40 ethyl. Particular preference is given to compounds I in which R¹
and R² together form a 4-methylpiperidin-1-yl group.

Special preference is given to compounds I in which R¹ is not
hydrogen.

45

10

In addition, particular preference is also given to compounds I in which R^1 is hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl or C_1 - C_4 -haloalkyl and R^2 is hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl, in particular hydrogen.

- 5 Preference is furthermore given to compounds I in which R^1 and R^2 do not carry any groups R^b , in particular to those in which R^1 and R^2 do not carry any groups R^a .

A further preferred object are compounds I in which R^1 and R^2 are
10 hydrogen.

Particular preference is also given to compounds I in which R^3 is C_3 - C_{12} -cycloalkyl, preferably cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cyclooctyl or cyclododecyl, or bicycloheptyl, where R^3
15 may carry one to three groups R^a . In particular, R^3 is unsubstituted.

Moreover, particular preference is given to compounds I in which X is C_1 - C_4 -alkyl, in particular methyl.
20

With a view to their use, particular preference is given to the compounds I compiled in the tables below. Moreover, the groups mentioned for a substituent in the tables are per se, independently of the combination in which they are mentioned, a
25 particularly preferred embodiment of the substituent in question.

Table 1

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclopropyl, X is methyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound
30 corresponds in each case to one row of Table A

Table 2

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclopropyl, X is ethyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound
35 corresponds in each case to one row of Table A

Table 3

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclopropyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a
40 compound corresponds in each case to one row of Table A

Table 4

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclopropyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a
45 compound corresponds in each case to one row of Table A

11

Table 5

Compounds of the formula I in which R³ is cyclopentyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

5

Table 6

Compounds of the formula I in which R³ is cyclopentyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

10

Table 7

Compounds of the formula I in which R³ is cyclopentyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

15

Table 8

Compounds of the formula I in which R³ is cyclopentyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

20

Table 9

Compounds of the formula I in which R³ is cyclohexyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

25

Table 10

Compounds of the formula I in which R³ is cyclohexyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

30

Table 11

Compounds of the formula I in which R³ is cyclohexyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

35

Table 12

Compounds of the formula I in which R³ is cyclohexyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

40

Table 13

Compounds of the formula I in which R³ is cycloheptyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

45

Table 14

Compounds of the formula I in which R^3 is cycloheptyl, X is ethyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

5

Table 15

Compounds of the formula I in which R^3 is cycloheptyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

10

Table 16

Compounds of the formula I in which R^3 is cycloheptyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

15

Table 17

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclooctyl, X is methyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

20

Table 18

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclooctyl, X is ethyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

25

Table 19

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclooctyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

30

Table 20

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclooctyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

35

Table 21

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclododecyl, X is methyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

40

Table 22

Compounds of the formula I in which R^3 is cyclododecyl, X is ethyl and the combination of the radicals R^1 and R^2 for a compound corresponds in each case to one row of Table A

45

13

Table 23

Compounds of the formula I in which R³ is cyclododecyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

5

Table 24

Compounds of the formula I in which R³ is cyclododecyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

10

Table 25

Compounds of the formula I in which R³ is bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

15

Table 26

Compounds of the formula I in which R³ is bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

20

Table 27

Compounds of the formula I in which R³ is bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

25

Table 28

Compounds of the formula I in which R³ is bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

30

Table 29

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclopentyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

35

Table 30

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclopentyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

40

Table 31

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclopentyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

45

Table 32

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclopentyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

5

Table 33

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclopentyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

10

Table 34

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclopentyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

15

Table 35

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclopentyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

20

Table 36

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclopentyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

25

Table 37

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclohexyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

30

Table 38

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclohexyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

35

Table 39

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclohexyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

40

Table 40

Compounds of the formula I in which R³ is 2-methylcyclohexyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

45

15

Table 41

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclohexyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

5

Table 42

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclohexyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

10

Table 43

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclohexyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

15

Table 44

Compounds of the formula I in which R³ is 3-methylcyclohexyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

20

Table 45

Compounds of the formula I in which R³ is 4-methylcyclohexyl, X is methyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

25

Table 46

Compounds of the formula I in which R³ is 4-methylcyclohexyl, X is ethyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

30

Table 47

Compounds of the formula I in which R³ is 4-methylcyclohexyl, X is n-propyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

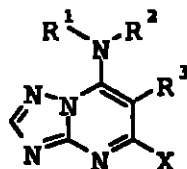
35

Table 48

Compounds of the formula I in which R³ is 4-methylcyclohexyl, X is isopropyl and the combination of the radicals R¹ and R² for a compound corresponds in each case to one row of Table A

40

Table A



I

45

16

No.	R ¹	R ²
A-1	H	H
A-2	CH ₂ CH ₃	H
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃
5 A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-5	CH ₂ CF ₃	H
A-6	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
10 A-8	CH ₂ CCl ₃	H
A-9	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
15 A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH(CH ₃) ₂	H
A-16	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
20 A-18	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-19	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-20	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-21	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-22	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
25 A-23	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-24	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
30 A-28	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-29	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-30	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
35 A-33	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
40 A-37	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-38	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
45 A-42	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃

17

No.	R ¹	R ²
A-45	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-46	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-47	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
5 A-48	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
10 A-52	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-55	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-56	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
15 A-57	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
20 A-62	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-64	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-65	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
25 A-66	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-67	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-68	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-70	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
30 A-71	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-72	cyclopentyl	H
A-73	cyclopentyl	CH ₃
A-74	cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-75	cyclohexyl	H
35 A-76	cyclohexyl	CH ₃
A-77	cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-78	-(CH ₂) ₄ -	
A-79	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-80	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
40 A-81	-(CH ₂) ₅ -	
A-82	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-83	-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -	
A-84	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
45 A-85	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-86	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-87	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	

18

No.	R ¹	R ²
A-88	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-89	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-90	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-91	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	

The compounds I are suitable for use as fungicides. They have outstanding activity against a broad spectrum of phytopathogenic fungi, in particular from the class of the *Ascomycetes*, *Deuteromycetes*, *Phycomycetes* and *Basidiomycetes*. Some of them act systemically, and they can be employed in crop protection as foliar- and soil-acting fungicides.

They are especially important for controlling a large number of fungi on a variety of crop plants such as wheat, rye, barley, oats, rice, maize, grass, bananas, cotton, soya, coffee, sugar cane, grapevines, fruit species, ornamentals and vegetables such as cucumbers, beans, tomatoes, potatoes and cucurbits, and on the seeds of these plants.

Specifically, they are suitable for controlling the following plant diseases:

- *Alternaria* species on vegetables and fruit,
- *Bipolaris* and *Drechslera* species on cereals, rice and turf,
- *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
- *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamentals and grapevines,
- *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
- *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
- *Mycosphaerella* species on cereals, bananas and peanuts,
- *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
- *Plasmopara viticola* on grapevines,
- *Podosphaera leucotricha* on apples,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* on wheat and barley,
- *Pseudoperonospora* species on hops and cucumbers,
- *Puccinia* species on cereals,
- *Pyricularia oryzae* on rice,
- *Rhizoctonia* species on cotton, rice and lawn,
- *Septoria tritici* and *Stagonospora nodorum* on wheat,
- *Uncinula necator* on grapevines,
- *Ustilago* species on cereals and sugar cane, and also
- *Venturia* species (scab) on apples and pears.

19

Moreover, the compounds I are suitable for controlling harmful fungi such as *Paecilomyces variotii* in the protection of materials (e.g. wood, paper, paint dispersions, fibers and fabrics) and in the protection of stored products.

5

The compounds I are applied by treating the fungi or the plants, seeds, materials or the soil to be protected against fungal infection with a fungicidally active amount of the active compounds. Application can be effected both before and after

10 infection of the materials, plants or seeds by the fungi.

In general, the fungicidal compositions comprise from 0.1 to 95, preferably 0.5 to 90, % by weight of active compound.

15 When used in crop protection, the rates of application are from 0.01 to 2.0 kg of active compound per ha, depending on the nature of the desired effect.

In the treatment of seed, amounts of active compound of from
20 0.001 to 1 g, preferably 0.01 to 0.05 g, are generally required per kilogram of seed.

When used in the protection of materials or stored products, the rate of application of active compound depends on the nature of
25 the field of application and on the desired effect. Rates of application conventionally used in the protection of materials are, for example, from 0.001 g to 2 kg, preferably 0.005 g to 1 kg, of active compound per cubic meter of material treated.

30 The compounds I can be converted into the customary formulations, e.g. solutions, emulsions, suspensions, dusts, powders, pastes and granules. The use form depends on the particular purpose; in any case, it should ensure a fine and uniform distribution of the compound according to the invention.

35

The formulations are prepared in a known manner, e.g. by extending the active compound with solvents and/or carriers, if desired using emulsifiers and dispersants. Solvents/auxiliaries which are suitable are essentially:

40

water, aromatic solvents (for example Solvesso products, xylene), paraffins (for example mineral oil fractions), alcohols (for example methanol, butanol, pentanol, benzyl alcohol), ketones (for example cyclohexanone,

45

gamma-butyrolactone), pyrrolidones (NMP, NOP), acetates (glycol diacetate), glycols, fatty acid dimethylamides, fatty

20

acids and fatty acid esters. In principle, solvent mixtures may also be used,

- 5 carriers such as ground natural minerals (e.g. kaolins, clays, talc, chalk) and ground synthetic minerals (e.g. highly disperse silica, silicates); emulsifiers such as nonionic and anionic emulsifiers (e.g. polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates and arylsulfonates) and dispersants such as lignosulfite waste liquors and
10 methylcellulose.

- Suitable surfactants used are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutyl-naphthalenesulfonic acid,
15 alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ether, furthermore condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and
20 formaldehyde, polyoxyethylene octylphenol ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether, tristerylphenyl polyglycol ether, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty alcohol/ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil,
25 polyoxyethylene alkyl ethers, ethoxylated polyoxypropylene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

- Substances which are suitable for the preparation of directly
30 sprayable solutions, emulsions, pastes or oil dispersions are mineral oil fractions of medium to high boiling point, such as kerosene or diesel oil, furthermore coal tar oils and oils of vegetable or animal origin, aliphatic, cyclic and aromatic hydrocarbons, e.g. toluene, xylene, paraffin, tetrahydro-
35 naphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol, ethanol, propanol, butanol, cyclohexanol, cyclohexanone, isophorone, strongly polar solvents, e.g. dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone or water.

- 40 Powders, materials for spreading and dusts can be prepared by mixing or concomitantly grinding the active substances with a solid carrier.

- Granules, e.g. coated granules, impregnated granules and
45 homogeneous granules, can be prepared by binding the active compounds to solid carriers. Examples of solid carriers are mineral earths, such as silica gels, silicates, talc, kaolin,

21

attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate, magnesium sulfate, magnesium oxide, ground synthetic materials, fertilizers, e.g. ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, ureas, and
5 products of vegetable origin, such as cereal meal, tree bark meal, wood meal and nutshell meal, cellulose powders and other solid carriers.

In general, the formulations comprise from 0.01 to 95% by weight,
10 preferably from 0.1 to 90% by weight, of the active compound. The active compounds are in this case employed in a purity of from 90% to 100%, preferably 95% to 100% (according to NMR spectrum).

The following are exemplary formulations:

15

1. Products for dilution with water

A Soluble concentrates (SL)

10 parts by weight of a compound according to the invention
20 are dissolved in water or in a water-soluble solvent. As an alternative, wetters or other auxiliaries are added. The active compound dissolves upon dilution with water.

B Dispersible concentrates (DC)

25 20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in cyclohexanone with addition of a dispersant, for example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion.

30 C Emulsifiable concentrates (EC)

15 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5% strength). Dilution with water gives an emulsion.

35

D Emulsions (EW, EO)

40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each
40 case 5% strength). This mixture is introduced into water by means of an emulsifier (Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion.

E Suspensions (SC, OD)

45 In an agitated ball mill, 20 parts by weight of a compound according to the invention are comminuted with addition of dispersant, wetters and water or an organic solvent to give a

22

fine active compound suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound.

- F Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG,
5 SG)
50 parts by weight of a compound according to the invention are ground finely with addition of dispersants and wetters and made into water-dispersible or water-soluble granules by means of technical appliances (for example extrusion, spray
10 tower, fluidized bed). Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound.
- G Water-dispersible powders and water-soluble powders (WP, SP)
75 parts by weight of a compound according to the invention
15 are ground in a rotor-stator mill with addition of dispersant, wetters and silica gel. Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound.
2. Products to be applied undiluted
20
- H Dustable powders (DP)
5 parts by weight of a compound according to the invention are ground finely and mixed intimately with 95% of finely divided kaolin. This gives a dustable product.
25
- I Granules (GR, FG, GG, MG)
0.5 part by weight of a compound according to the invention is ground finely and associated with 95.5% carriers. Current methods are extrusion, spray-drying or the fluidized bed.
30 This gives granules to be applied undiluted.
- J ULV solutions (UL)
10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in an organic solvent, for example xylene. This
35 gives a product to be applied undiluted.

The active compounds can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom, e.g. in the form of directly sprayable solutions, powders, suspensions or
40 dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dusts, materials for spreading, or granules, by means of spraying, atomizing, dusting, spreading or pouring. The use forms depend entirely on the intended purposes; in any case, they are intended to ensure the finest possible distribution of the active compounds
45 according to the invention.

23

Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions, pastes or oil dispersions, the substances as such or dissolved in an oil or solvent can be
5 homogenized in water by means of wetter, tackifier, dispersant or emulsifier. Alternatively, it is possible to prepare concentrates composed of active substance, wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

10

The active compound concentrations in the ready-to-use preparations can be varied within substantial ranges. In general, they are from 0.0001 to 10%, preferably from 0.01 to 1%.

15 The active compounds may also be used successfully in the ultra-low-volume process (ULV), it being possible to apply formulations comprising over 95% by weight of active compound, or even the active compound without additives.

20 Various types of oils, wetting agents, adjuvants, herbicides, fungicides, other pesticides, or bactericides may be added to the active compounds, if appropriate also just prior to use (tank mix). These agents can be admixed with the agents according to the invention in a weight ratio of 1:10 to 10:1.

25

In the use form as fungicides, the compositions according to the invention can also be present together with other active compounds, e.g. with herbicides, insecticides, growth regulators, fungicides or else with fertilizers. Mixing the compounds I or

30 the compositions comprising them in the use form as fungicides with other fungicides frequently results in a broader fungicidal spectrum of action.

The following list of fungicides, together with which the
35 compounds according to the invention can be used, is intended to illustrate the possible combinations, but not to impose any limitation:

- acylalanines such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace, oxadixyl,
- 40 • amine derivatives such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminocadine, spiroxamin, tridemorph
- anilinopyrimidines such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyrodinyl,
- 45 • antibiotics such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,

24

- azoles such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinitroconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole,
- 5 propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazole,
- dicarboximides such as iprodion, myclozolin, procymidon, vinclozolin,
- dithiocarbamates such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb,
- 10 metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram, zineb,
- heterocyclic compounds such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole,
- 15 flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenox, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole, triforine,
- copper fungicides such as Bordeaux mixture, copper acetate,
- 20 copper oxychloride, basic copper sulfate,
- nitrophenyl derivatives such as binapacryl, dinocap, dinobuton, nitrophthalisopropyl
- phenylpyrroles such as fenpiclonil or fludioxonil,
- sulfur
- 25 • other fungicides such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, diclomezin, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin-acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum,
- 30 iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenon, pencycuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-methyl, quintozone, zoxamide
- strobilurins such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin,
- 35 orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- sulfenic acid derivatives such as captafol, captan, dichlofluanid, folpet, tolylfluanid
- cinnamides and analogs such as dimethomorph, flumetover or
- 40 flumorph.

25

Synthesis Examples

With due modification of the starting compounds, the procedures shown in the synthesis examples below were used to obtain further 5 compounds I. The resulting compounds, together with physical data, are listed in the table below.

Example 1 Preparation of ethyl 2-cyclopentyl-3-oxobutanoate

10 A mixture of ethyl 3-oxobutanoate (0.5 mol), cyclopentyl bromide (0.5 mol) and sodium ethoxide (0.5 mol) in ethanol (100 ml) was heated under reflux for 15 hours. The reaction mixture was cooled to about 20-25°C, and 71 g of the title compound were then isolated by distillation (96-100°C, 0.25 mbar).

15

Example 2 Preparation of 5-methyl-6-cyclopentyl-7-hydroxy-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine

A mixture of 3-amino-1,2,4-triazole (14 g), ethyl 2-cyclopentyl-3-oxobutanoate (0.17 mol, Ex. 1) and tributylamine (50 ml) was heated at 180°C for 6 hours. The reaction mixture was cooled to about 70°C, and aqueous NaOH solution (21 g in 200 ml of H₂O) was then added and the solution was stirred for another 30 min. Following phase separation and extraction with diethyl 25 ether, the aqueous phase was acidified with conc. HCl solution. The precipitate gave 19 g of the title compound.

Example 3 Preparation of 5-methyl-6-cyclopentyl-7-chloro[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pyrimidine

30

A mixture of 5-methyl-6-cyclopentyl-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine (17 g, Ex. 2) and POCl₃ (50 ml) was heated under reflux for 8 35 hours. During this operation, some of the POCl₃ was distilled off. The residue was poured into a mixture of dichloromethane and water. The organic phase was separated off and dried. Removal of the solvent gave 11 g of the title compound of m.p. 87°C.

40 Example 4 Preparation of 5-methyl-6-cyclopentyl-7-(4-methyl-piperidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine [I-1]

With stirring, a solution of 4-methylpiperidine (1.5 mmol) and 45 triethylamine (1.5 mmol) in 10 ml of dichloromethane was added to a solution of 5-methyl-6-cyclopentyl-7-chloro[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine

26

(1.5 mmol, Ex. 3) in 20 ml of dichloromethane. The reaction mixture was stirred at 20-25°C for about 16 hours and then washed with a 5% strength solution of HCl. The organic phase was separated off and dried. Following distillative removal of the solvent and chromatography on silica gel, this gave 0.26 g of the title compound of m.p. 145°C.

Table I: Compounds of the formula I

10	No.	R ¹	R ²	R ³	X	phys. data (m.p. [°C], IR [cm ⁻¹])
	I-1	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		cyclopentyl	CH ₃	145
	I-2	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	cyclopentyl	CH ₃	96
15	I-3	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	cyclopentyl	CH ₃	108
	I-4	H	H	cyclopentyl	CH ₃	271
	I-5	CH ₃	H	cyclopentyl	CH ₃	175
	I-6	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	cyclopentyl	CH ₃	1960; 1605; 1590; 1240

20

25

30

35

40

45

27

Examples of the action against harmful fungi

The fungicidal action of the compounds of the formula I was demonstrated by the following experiments:

5

The active compounds were formulated separately as a stock solution comprising 0.25% by weight of active compound in acetone or DMSO. 1% by weight of the emulsifier Uniperol® EL (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on
10 ethoxylated alkylphenols) was added to this solution. The stock solutions of the active compounds were diluted with water to the stated concentration.

Example 1: Activity against early blight of tomato caused by
15 *Alternaria solani*

Leaves of potted plants of the cultivar "Große Fleischtomate St. Pierre" were sprayed to run off point with an aqueous suspension having the concentration of active compound stated below. The
20 next day, the leaves were infected with an aqueous spore suspension of *Alternaria solani* in a 2% strength biomalt solution of a density of 0.17×10^6 spores/ml. The plants were then placed in a water-vapor-saturated chamber at 20-22°C. After 5 days, the early blight on the untreated but infected control plants had
25 developed to such an extent that the infection could be determined visually in %.

In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of active compound I-1 showed no infection, whereas the untreated
30 plants were 90% infected.

Example 2: Activity against gray mold on bell pepper leaves caused by *Botrytis cinerea*, protective application

35 bell pepper seedlings of the cultivar "Neusiedler Ideal Elite" were, after 4-5 leaves were well developed, sprayed to run off point with an aqueous suspension of the concentration of active compound stated below. The next day, the treated plants were inoculated with a spore suspension of *Botrytis cinerea* which
40 contained 1.7×10^6 spores/ml in a 2% strength aqueous biomalt solution. The test plants were then placed in a climatized chamber at 22-24°C and high atmospheric humidity. After 5 days, the extent of the fungal infection on the leaves could be determined visually in %.

45

28

In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of active compound I-1 or I-3 showed at most 20% of infection, whereas the untreated plants were 90% infected.

5 Example 3 - Activity against mildew on cucumber leaves caused by *Sphaerotheca fuliginea*, protective application

Leaves of potted cucumber seedlings of the cultivar "Chinese Snake" were, at the cotyledone stage, sprayed to run off point
10 with an aqueous suspension of the concentration of active compound stated below. 20 hours after the spray coating had dried on, the plants were inoculated with an aqueous spore suspension of mildew of cucumber (*Sphaerotheca fuliginea*). The plants were then cultivated in a greenhouse at 20-24°C and 60-80% relative
15 atmospheric humidity for 7 days. The extent of the mildew development was then determined visually in % infection of the cotyledone area.

In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of
20 active compound I-1 or I-3 showed an infection of not more than 3%, whereas the untreated plants were 90% infected.

25

30

35

40

45

We claim:

1. A 5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidine of the formula I,



10 where:

R¹, R² are hydrogen, C₁-C₁₀-alkyl, C₂-C₁₀-alkenyl, C₂-C₁₀-alkynyl, C₁-C₁₀-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, phenyl, naphthyl; or

5- or 6-membered saturated, unsaturated or aromatic heterocyclyl which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; or

R¹ and R² together with the bridging nitrogen atom can form a 5- or 6-membered ring which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom;

if R^1 and R^2 are not hydrogen they can, independently of one another, be partially or fully halogenated and/or may carry one to three radicals from the group R^a

R^a is cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-alkynyloxy and unhalogenated or halogenated oxy-C₁-C₄-alkyleneoxy;

where these aliphatic, or alicyclic, groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups R^b :

R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkyl-

30

- sulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals contain 1 to 6 carbon atoms and the alkenyl or alkynyl groups mentioned in these radicals contain 2 to 8 carbon atoms;
- and/or one to three of the following radicals:
- cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocycllyoxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C₁-C₆-alkoxy, aryl-C₁-C₆-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to 10 ring members, the hetaryl radicals contain 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or may be substituted by alkyl or haloalkyl groups;
- R³ is C₃-C₁₄-cycloalkyl or C₆-C₁₄-bicycloalkyl, where R³ may be unsubstituted or partially or fully halogenated and/or may carry one to three radicals from the group R^a; and
- X is C₁-C₆-alkyl or C₁-C₂-haloalkyl;
- and its salts.
2. A 5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidine of the formula I as claimed in claim 1 where:
- R¹, R² are hydrogen, C₁-C₁₀-alkyl, C₂-C₁₀-alkenyl, C₂-C₁₀-alkynyl, C₁-C₁₀-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, phenyl, naphthyl; or
- 5- or 6-membered saturated, unsaturated or aromatic heterocyclyl which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; or
- R¹ and R² together with the bridging nitrogen atom can form a 5- or 6-membered ring which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one

31

sulfur or oxygen atom;

if R¹ and R² are not hydrogen they can, independently of one another, be partially or fully halogenated and/or may carry one to three radicals from the group R^a

R^a is cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-alkynyloxy and unhalogenated or halogenated oxy-C₁-C₄-alkyleneoxy;

R³ is C₃-C₁₄-cycloalkyl or C₆-C₁₄-bicycloalkyl, where R³ may be unsubstituted or partially or fully halogenated and/or may carry one to three radicals from the group R^a; and

X is C₁-C₆-alkyl;

and its salts.

3. A compound of the formula I as claimed in claim 1 or 2 in which X is methyl.

4. A process for preparing compounds of the formula I as claimed in claim 1, which comprises cyclizing dicarbonyl compounds of the formula II



where A is C₁-C₁₀-alkoxy and R³ and X are as defined for formula I with 3-amino-1,2,4-triazole to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula III



and halogenating III with a halogenating agent to give 7-halogen-triazolopyrimidines of the formula IV

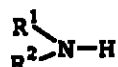


28

32

where Hal is halogen, followed by reaction with an amine of the formula V

5



V

where R¹ and R² are as defined in formula I, to give 5-alkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I.

- 10 5. A compound of formula III or IV as defined in claim 4.
6. A composition suitable for controlling phytopathogenic harmful fungi, which composition comprises a solid or liquid carrier and a compound of the formula I as claimed in claim 1.
- 15 7. Seeds, comprising a compound of the formula I as claimed in claim 1 in an amount of from 0.001 to 1 g/kg.
- 20 8. The use of the compounds of the formula I as claimed in claim 1 for preparing a composition suitable for controlling harmful fungi.
9. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or the seeds to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I as claimed in claim 1.

30

35

40

45

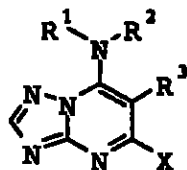
5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes and intermediates for their preparation, compositions comprising them and their use for controlling harmful fungi

5

Abstract

5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I,

10



I

where:

15

R¹, R² are hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, cycloalkyl, phenyl, naphthyl; 5- or 6-membered saturated, unsaturated or aromatic heterocyclyl which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; or

20

R¹ and R² together with the bridging nitrogen atom can form a 5- or 6-membered ring which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom;

25

R³ is cycloalkyl or bicycloalkyl;

30

where R¹, R² and R³ may be substituted as outlined in the description;

X is alkyl or haloalkyl;

and their salts;

35

processes and intermediates for their preparation, compositions comprising them and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi are described.

40

45

PATENT COOPERATION TREATY

UP 05.05.05

PCT

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

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

PBR

10. Sep. 2004

BASF AKTIENGESELLSCHAFT
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen
Germany1. AST
2 Ref

Date of mailing (day/month/year)

31 August 2004 (31.08.2004)

Applicant's or agent's file reference

0000054041

International application No.

PCT/EP2003/012277

International filing date (day/month/year)

04 November 2003 (04.11.2003)

IMPORTANT NOTIFICATION

1. The following indications appeared on record concerning:



the applicant



the inventor



the agent



the common representative

Name and Address

GRAMMENOS, Wassilios
Alexander-Fleming-Str. 13
67071 Ludwigshafen
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

GRAMMENOS, Wassilios
Alexander-Fleming-Str. 13
67071 Ludwigshafen
Germany

State of Nationality

GR

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

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



the receiving Office



the International Searching Authority



the International Preliminary Examining Authority



the designated Offices concerned



the elected Offices concerned



other:

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

Facsimile No. (41-22) 338.70.80

Authorized officer

Chantal AUMAITRE

Telephone No. (41-22) 338 8889

✓N:

PATENT COOPERATION TREATY

81

PCT

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

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

BASF AKTIENGESELLSCHAFT
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen
Germany

Date of mailing (day/month/year)

31 August 2004 (31.08.2004)

Applicant's or agent's file reference

0000054041

International application No.

PCT/EP2003/012277

International filing date (day/month/year)

04 November 2003 (04.11.2003)

IMPORTANT NOTIFICATION

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

TORMO I BLASCO, Jordi
Carl-Benz-Str. 10-3
69514 Laudendbach
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

TORMO I BLASCO, Jordi
Carl-Benz-Str. 10-3
69514 Laudendbach
Germany

State of Nationality

ES

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

Facsimile No. (41-22) 338.70.80

Authorized officer

Chantal AUMAITRE

Telephone No. (41-22) 338 8689

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

3
82

PCT INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT (Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054041	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12277	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 04.11.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 07.11.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT). Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.		
3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: I ☒ Grundlage des Bescheids II ☐ Priorität III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 20.04.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 24.08.2004	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - Gilchiner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Hoepfner, W Tel. +49 30 25901-337 	

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12277

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der Bestandteile der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17):*

Beschreibung, Seiten

1-27 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-9 in der ursprünglich eingereichten Fassung

2. Hinsichtlich der Sprache: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

**INTERNATIONALER VERLÄUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12277

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- | | |
|--------------------------------|--------------------------------------|
| 1. Feststellung | |
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-9
Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-9
Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche 1-9
Nein: Ansprüche |

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

D1: WO-A-02083677

D2: EP-A-0141317

Neuheit

Das Dokument D1 hat Fungizide zum Gegenstand, die sich von den Verbindungen des Anspruchs 1 dadurch unterscheiden, dass in 6-Stellung ein 2-Chlor-6-fluorbenzolsubstituent vorhanden ist und der Substituent "X" in 5-Stellung ausgewählt ist aus Cyano-, Alk(en)yoxy- oder Haloalkoxygruppen (vgl. Seite 1, Formel I; Seite 10, Zeile 18 - Seite 11, Zeile 12).

Das Dokument D2 hat Fungizide zum Gegenstand, die sich von den Verbindungen des Anspruchs 1 dadurch unterscheiden, dass der Substituent in 6-Stellung eine (Ar)alkylgruppe ist (vgl. Seite 1, Formel I; Seite 9, Tabelle, Verb. Nr. 9; Seite 10, Zeile 34 - Seite 11, Zeile 2).

Angesichts dieses Sachstandes muss für den Gegenstand der unabhängigen Ansprüche 1, 4 und 6-9 sowie der abhängigen Ansprüche 2, 3 und 5 Neuheit anerkannt werden.

Erfinderische Tätigkeit

D1 wird als nächster Stand der Technik für die neuen Ansprüche angesehen, da es den Verbindungen aus Anspruch 1 strukturell näher kommt (cyclischer Substituent in 6-Stellung) und die selbe Aufgabe löst. Unterscheidungsmerkmal ist die spezielle Kombination einer Gruppe "X" mit der Bedeutung (Halo)alkyl in 5-Stellung mit einer gesättigten cyclischen Gruppe in 6-Stellung.

In Abwesenheit von Anhaltspunkten für einen technischen Effekt, der mit diesem Merkmal verbunden ist, kann die objektive Aufgabe, die durch dieses Merkmal gelöst wird, lediglich gesehen werden in der Bereitstellung weiterer Fungizide und eines Verfahrens zu ihrer Herstellung.

Da die beanspruchte Lösung dieser Aufgabe, nämlich die oben beschriebene spezielle

Kombination von Substituenten, dem Stand der Technik nicht entnehmbar war, muss für diese Lösung, auch in Abwesenheit eines technischen Effektes, erfinderische Tätigkeit anerkannt werden.

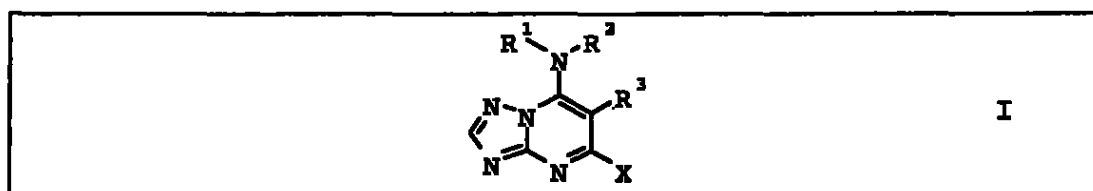
Gewerbliche Anwendbarkeit

Es besteht kein Zweifel, dass der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche gewerblich anwendbar ist.

5-alkil-7-aminotriazolopirimidinas, procedimientos y productos intermedios para su obtención, productos que las contienen y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos

Descripción

La presente invención se refiere a 5-alkil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I,



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R^1, R^2 significan hidrógeno, alquilo- C_1-C_{10} , alqueno- C_2-C_{10} , alquino- C_3-C_{10} , haloalquilo- C_1-C_{10} , cicloalquilo- C_1-C_6 , fenilo, naftilo; o

heterociclilo saturado, no saturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno; o

R^1 y R^2 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, que los une, un anillo con 5 ó 6 miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno;

PF 54041

R¹ y R², si no significan hidrógeno, pueden estar, independientemente, parcial o completamente halogenados y/o llevar uno a tres radicales del grupo R³

R³ es ciano, nitro, hidroxilo, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilamino-C₁-C₆, di-alquilamino-C₁-C₆, alquenilo-C₃-C₆, alquenilo-C₃-C₆, alquinoxio-C₁-C₆, alquinoxio-C₁-C₆, alquinoxio-C₁-C₆ y oxi-alquinoxio-C₁-C₆, opcionalmente halogenado;

R³ significa cicloalquilo-C₃-C₆, o bicicloalquilo-C₃-C₆, pudiendo R³ estar no sustituido o parcial o completamente halogenado y/o llevar de uno a tres radicales del grupo R³; y

X significa alquilo-C₁-C₆;

y sus sales.

Además, la presente invención se refiere a procedimientos y productos intermedios para la obtención de los compuestos I, así como a productos y el uso de los compuestos I para combatir hongos fitopatógeno.

6-Aril-triazolopirimidinas se divulgan en las memorias WO 98/46608 y EP-A 550 113. 6-Bencil-triazolopirimidinas sustituidas especialmente por grupos aromáticos con acción farmacéutica se conocen de la US 5,231,094 y US 5,387,747. La EP-A 141 317 divulga 6-aril- y 6-arilalquil-7-aminotriazolopirimidinas, que pueden llevar un radical alquilo

PF 54041

en la posición 5. 6-Cicloalquiltriazolopirimidinas con diversos radicales en la posición 5 se mencionan en la EP-A 613 900. 5-Alquil-6-fenil-7-aminotriazolopirimidinas se conocen de la US 5,994,360.

Los compuestos descritos en la WO 98/46608, EP-A 550 113, EP-A 141 317, EP-A 613 900 y US 5,994,360 son bien apropiados como agentes fitosanitarios contra hongos nocivos.

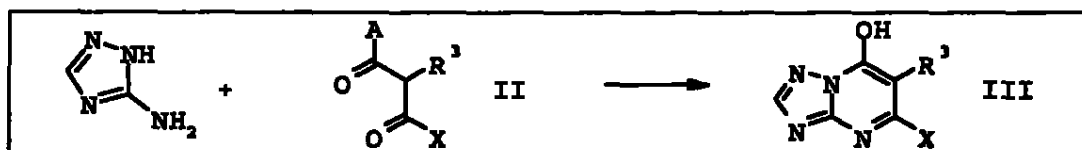
Sin embargo, su efecto es insatisfactorio en muchos casos, por lo que existió la tarea de encontrar compuestos con eficiencia mejorada.

Por tanto, se encontraron las 5-alquil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I. Además, se encontraron productos intermedios y procedimientos para la obtención de los compuestos I, así como el uso de los compuestos y de productos que las contienen para combatir hongos fitopatógenos.

Los compuestos de la fórmula I se distinguen de los compuestos mencionados en las publicaciones arriba mencionadas en la combinación del grupo 5-alquilo con el grupo R¹, que es un grupo cicloalquilo mono o bicíclico, en el esqueleto de triazolopirimidina.

7-Aminotriazolopirimidinas de la fórmula I se pueden preparar, ventajosamente, haciendo reaccionar 3-amino-1,2,4-triazol con compuesto de dicarbonilo de la fórmula II, en la que A es alcoxi con 1 a 10 átomos de carbono, especialmente alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y R¹ y X tienen las definiciones

indicadas en la fórmula I, dando 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula III:



Esta reacción se realiza, generalmente, a temperaturas de 25°C a 210°C, preferentemente, 120°C a 180°C, en presencia de una base [ver EP-A-770 615].

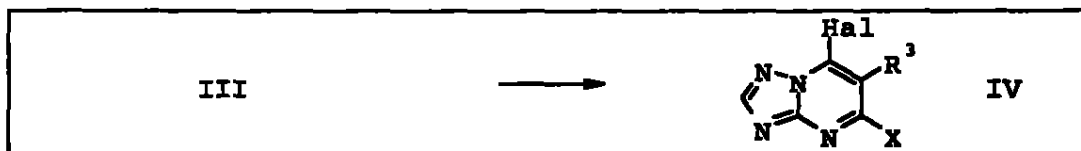
Como bases son apropiadas las bases orgánicas, p.ej. aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, triisopropiletilamina, tributilamina y N-metilpiperidina, piridina. Se prefiere, especialmente, la trietilamina y tributilamina.

Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también es posible usarlas en cantidad equimolar, en exceso o, opcionalmente, como disolvente.

Los eductos suelen ser reaccionados entre si en cantidades equimolares. Pero para el rendimiento puede ser ventajoso usar II en exceso con respecto al aminotriazol.

Las sustancias de partida necesarias para la obtención de los compuestos I se describen en la literatura citada o pueden ser preparados según la literatura citada [Heterocycl. 1996, p.1031; Tetrahedron Lett. 1966, vol.24, p.2661; Chem. Pharm. Bull. 1961, p.801] o se venden en el comercio.

A continuación, se transforman las 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula III con un agente de halogenación en 7-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula IV:

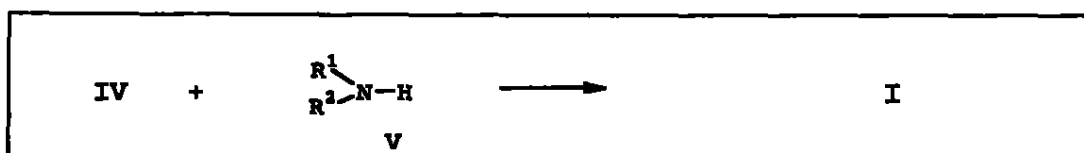


Esta reacción se efectúa, generalmente, a temperaturas de 0°C a 150°C, preferentemente, 80°C a 125°C, en un disolvente orgánico inerte o sin disolvente [ver EP-A-770 615].

Como agente de halogenación se usan, preferentemente, agentes de bromación o cloración, tales como oxibromuro fosfórico o oxicloruro fosfórico, en sustancia o en presencia de un disolvente.

Disolventes apropiados son los hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano y petroléter, los hidrocarburos aromáticos, tales como hidrocarburos aromático, como p.ej. tolueno, o, m- y p-xileno, muy preferentemente, tolueno, o, m- y p-xileno. También se pueden usar mezclas de los disolventes mencionados.

Las halógenotriazolopirimidinas de la fórmula IV son transformadas con una amina de la fórmula V en 7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I.



Esta reacción se efectúa, generalmente, a temperaturas de 0°C a 70°C, preferentemente, 10°C a 35°C, en un disolvente orgánico inerte, en presencia de una base [ver EP-A 550 113].

Disolventes apropiados son los hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, o, m- y p-xileno, los hidrocarburos halogenados, tales como cloruro metilénico, cloroformo y clorobenceno, los éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc.-butilmetílico, dioxano, anisol y tetrahidrofurano.

Como bases son apropiados, generalmente, los compuestos inorgánicos, tales como hidróxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, óxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, hidruros de metal alcalino y alcalinotérreo, amidas de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, tales como carbonato de litio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, así como los hidrogencarbonatos de metal alcalino, p.ej. hidrogencarbonato de sodio, compuestos de metal aorgánicos, especialmente, alquilos de metal alcalino, haluros de alquilmagnesio, así como alcoholatos de metal alcalino y alcalinotérreo y dimetoximagnesio, además, las bases orgánicas, p.ej. aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tri-isopropiletilamina y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas y aminas bicíclicas. Muy preferentemente, se usan trietilamina, carbonato de potasio y carbonato de sodio.

PF 54041

Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también es posible usarlas en cantidad equimolar, en exceso o, opcionalmente, como disolvente. Alternativamente, se puede usar un exceso del compuesto V como base.

Los eductos suelen ser reaccionados entre si en cantidades equimolares. Pero para el rendimiento puede ser ventajoso usar V en exceso con respecto a IV.

Las mezclas de reacción pueden ser elaboradas ulteriormente mediante métodos conocidos, p.ej. mezclándolas con agua, separación de las fases y, en caso dado, purificación cromatográfica de los productos crudos. Los productos intermedios y finales se obtienen, en parte, en forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente parduzcos, que bajo presión reducida y a temperatura moderadamente elevada son librados de los componentes volátiles o purificados. Siempre que se puedan obtener los productos intermedios y finales como sólidos, estos pueden ser purificados también por recristalización o digestión.

Si algunos compuestos I nc. pueden ser preparados en la forma antes descrita, entonces se puede obtenerlos por derivatización de otros compuestos I.

Las 7-hidroxi- y 7-halógenotriazolopirimidinas de las fórmulas III y IV, donde X y R' tienen los significados indicados para la fórmula I, y Hal significa halógeno, especialmente, cloro o bromo, son nuevas.

PF 54041

En las definiciones de los símbolos de las fórmulas antes descritas se usaron términos colectivos, que son representativos para los sustituyentes siguientes:

halógeno: fluoro, cloro, bromo y yodo;

alquilo,os: radicales hidrocarburo saturados, lineales o ramificados con 1 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono, p.ej. alquilo-C₁-C₆, como p.ej. metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, y 1-etil-2-metilo, propilo;

haloalquilo: lineales o ramificados grupos alquilo con 1 a 10 átomos de carbono (como los arriba indicados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar sustituidos parcialmente, por ejemplo, mono a trisustituidos, por átomos de halógeno, como los arriba indicados, p.ej. halógenoalquilo-C₁-C₆, como p.ej. clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-

PF 54041

tricloroetilo, y pentafluoroetilo;

alquenilo: radicales hidrocarburo no saturados, lineales o ramificados con 2 a 6 ó 10 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria, p.ej. alquenilo-C₂-C₆, como p.ej. etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metilo, etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metilo-2-propenilo;

PF 54041

alquinilo, : grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 6 o 10 átomos de carbono y un triple enlace en una posición arbitraria, p.ej. alquinilo- C_2-C_6 , como p.ej. etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

cicloalquilo, : grupos hidrocarburo monocíclicos, saturados con 3 a 5, 6 ó 8 miembros anulares de carbono, p.ej. cicloalquilo- C_3-C_8 , como p.ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo;

bicicloalquilo, : grupos hidrocarburos bicíclicos, saturados con 6 a 14, especialmente, 7 ó 10 miembros anulares de carbono, compuestos de sistemas anulares anelados de 5, 6 y/ó 7 miembros.

heterociclilo de cinco o seis miembros (heterociclilo saturado), que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno o de azufre, p.ej. 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-

PF 54041

pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiraniilo, 4-tetrahidropiraniilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridacinilo, 4-hexahidropiridacinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo y 2-piperacinilo;

heterociclilo de cinco o seis miembros (heterociclilo no saturado), que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno o de azufre y uno o dos dobles enlaces de C=C, p.ej. 3,6-dihidro-2H-piridin-1-ilo o 2,5-dihidropirrol-1-ilo;

heteroarilo de cinco miembros, (heterociclilo aromático), que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno: grupos heteroarilo pentacíclicos, que junto con átomos de carbono pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros anulares, p.ej. 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-

PF 54041

imidazolilo, 4-imidazolilo, y 1,3,4-triazol-2-ilo;

heteroarilo de seis miembros, (heterociclilo aromático), que contiene de uno a tres o bien de uno a cuatro átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo hexacíclicos, que junto con átomos de carbono pueden contener de uno a tres o bien de uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros anulares, p.ej. 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridacinilo, 4-piridacinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-piracinilo;

oxialquilenoxi: cadenas divalentes no ramificadas de 1 a 3 grupos CH_2 , estando ambas valencias ligadas por vía de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p.ej. OCH_2O , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$;

Los compuestos de la fórmula I pueden estar presentes también en forma de sus sales apropiadas para la agricultura, siendo, generalmente, sin importancia el tipo de sal. Por lo general, son apropiadas las sales de aquellos cationes o las sales de adición ácida de aquellos ácidos, cuyos cationes o bien aniones no afectan negativamente el efecto de los compuestos I.

Como cationes son apropiados, especialmente, los iones de los metales alcalinos, preferentemente, litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferentemente, calcio y magnesio, y de los metales transitorios, preferentemente, manganeso, cobre, cinc y hierro, así como amonio, pudiendo, en caso de desearlo, uno a cuatro átomos de hidrógeno estar sustituidos por alquilo- $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialquilo- $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi- $\text{C}_1\text{-}$

PF 54041

C₁-alquilo-C₁-C₄, hidroxi-alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, fenilo, o bencilo, preferentemente, amonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutilamonio, 2-(2-hidroxiet-1-oxi)et-1-ilamonio, di(2-hidroxiet-1-il)amonio, trimetilbencilamonio, además, iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferentemente, tri(alquilo-C₁-C₄)sulfonio e iones de sulfoxonio, preferentemente, tri(alquil-C₁-C₄)sulfoxonio.

Aniones de sales de adición ácida apropiadas son, primordialmente, cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogensulfato, sulfato, dihidrogenfosfato, hidrogenfosfato, nitrato, hidrogencarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, así como las aniones de ácidos alcanoicos con 1 a 4 átomos de carbono, preferentemente, formiato, acetato, propionato y butirato.

..

Siempre que R¹ y/o R² presenten un centro de quiralidad, los isómeros (R) y (S) y los racématos de los compuestos de la fórmula I están comprendidos en el ámbito de la invención.

Las variantes especialmente preferidas de los productos intermedios en cuanto a las variables corresponden a aquellas de los radicales R¹ y X de la fórmula I.

Con respecto al uso a que están destinadas las 5-alquil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I, son preferidos los siguientes significados de los sustituyentes, tanto por si solos como en combinaciones:

Son preferidos los compuestos I, en los que R¹ y R² significan hidrógeno, alquilo-C₁-C₁₀, o haloalquilo-C₁-C₄, especialmente,

PF 54041

hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, muy preferentemente, hidrógeno, 1-metilpropilo, isopropilo, ó 1,1,1-trifluoro-2-propilo.

También son preferidos los compuestos I, en los que R¹ y R² forman junto con el átomo de nitrógeno que los une, un anillo de cinco o seis miembros, que puede contener un átomo de oxígeno o de azufre, como p.ej. pirrolidín-1-ilo, pirrol-1-ilo, pirazol-1-ilo, imidazol-1-ilo, piperidín-1-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 3,6-dihidro-2H-piridin-1-ilo, 2,5-dihidropirrol-1-ilo, pudiendo los grupos mencionados estar sustituidos por uno a tres grupos R³, especialmente, por alquilo-C₁-C₄, como p.ej. metilo, o etilo. Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ y R² forman juntos un grupo 4-metilpiperidín-1-ilo.

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ no significa hidrógeno.

Adicionalmente, son muy preferidos los compuestos I, en los que R¹ es alquilo-C₁-C₄, y haloalquilo-C₁-C₄, y R² hidrógeno o alquilo-C₁-C₄, especialmente, hidrógeno.

Además, son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R³ significa cicloalquilo-C₃-C₆, preferentemente, ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

Igualmente, son muy preferidos los compuestos I, en los que X significa metilo.

101

PF 54041

En cuanto a su uso son especialmente preferidos los compuestos I relacionados en las siguientes Tablas. Los grupos mencionados en la tablas para un sustituyente son, además, considerados por si solos, independientemente de la combinación en que se mencionan, una variante especialmente preferida del correspondiente sustituyente.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopropilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopropilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopropilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopropilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

PF 54041

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopentilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopentilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopentilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclopentilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclohexilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclohexilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclohexilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 12

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclohexilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 13

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa cicloheptilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa cicloheptilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa cicloheptilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa cicloheptilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclooctilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclooctilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclooctilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A



Tabla 20

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclooctilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 21

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclododecilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 22

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclododecilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclododecilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa ciclododecilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

PF 54041

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa biciclo[2.2.1]hept-2-ilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 26

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa biciclo[2.2.1]hept-2-ilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 27

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa biciclo[2.2.1]hept-2-ilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa biciclo[2.2.1]hept-2-ilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 29

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclopentilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

PF 54041

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclopentilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 31

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclopentilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 32

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclopentilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 33

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclopentilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 34

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclopentilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

PF 54041

Tabla 35

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclopentilo,

X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 36

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclopentilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 37

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclohexilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclohexilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 39

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclohexilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 40

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 2-metilciclohexilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 41

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclohexilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 42

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclohexilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 43

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclohexilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 44

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 3-metilciclohexilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 45

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 4-metilciclohexilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 46

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 4-metilciclohexilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

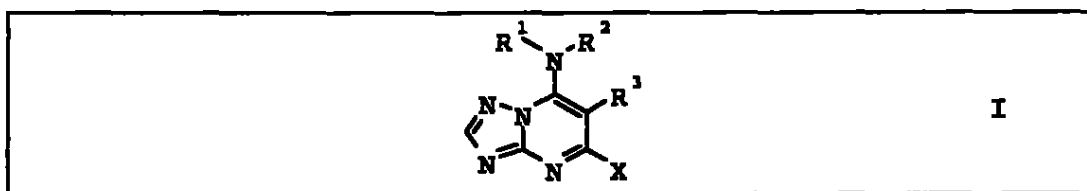
Tabla 47

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 4-metilciclohexilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 48

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa 4-metilciclohexilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla A





No.	R'	R'
A-1	H	H
A-2	CH ₂ CH ₃	H
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-5	CH ₂ CF ₃	H
A-6	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-8	CH ₂ CCl ₃	H
A-9	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH(CH ₃) ₂	H
A-16	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-18	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-19	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-20	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-21	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-22	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-23	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃

112

A-24	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-28	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-29	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-30	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-33	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-37	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-38	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-42	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-46	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-47	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃

A-48	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-55	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-56	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-64	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-65	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-66	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-67	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-68	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-70	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-71	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃

///X

A-72	ciclopentilo	H
A-73	ciclopentilo	CH ₃
A-74	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃
A-75	ciclohexilo	H
A-76	ciclohexilo	CH ₃
A-77	ciclohexilo	CH ₂ CH ₃
A-78	-(CH ₂) ₄ -	
A-79	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-80	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-81	-(CH ₂) ₅ -	
A-82	-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-83	-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -	
A-84	-(CH ₂) ₃ CH=CHCH ₂ -	
A-85	-(CH ₂) ₃ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-86	-(CH ₂) ₃ CHF(CH ₃) ₂ -	
A-87	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-88	-(CH ₂) ₃ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-89	-(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₂ -	
A-90	-(CH ₂) ₃ S(CH ₂) ₂ -	
A-91	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	

Los compuestos I son apropiados como fungicidas. Se destacan por presentar una excelente actividad contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, especialmente, de la clase de los *ascomicetos*, *deuteromicetos*, *ficomicetos* y

basidiomicetos. Algunos actúan sistémicamente y pueden ser usados en la fitosanidad como fungicidas foliares y del suelo.

Son especialmente importantes para controlar un amplio número de hongos en una variedad de plantas de cultivo, tales como trigo cebada, centeno, avena, arroz, maíz, pasto, plátanos, algodón, soya, café, caña de azúcar, vid, especies de frutas, plantas de adorno y legumbres, como p.ej. pepinos, frijoles, tomates, papas y cucurbitáceas y en las semillas de estas plantas.

Son especialmente apropiados para controlar las siguientes enfermedades de las plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
- especies de *Bipolaris* y *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
- *Blumeria graminis* (mildió) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (oídio) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- especies de *Fusarium* y *Verticillium* en diferentes plantas,
- especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Plasmopara viticola* on vid,
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales,

- *Pyricularia oryzae* en arroz,
- especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- *Uncinula necator* en vid,
- especies de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, y
- especies de *Venturia* (roña) en manzanas y peras.

Además, los compuestos I son apropiados para controlar hongos nocivos, como p.ej. *Paecilomyces variotii* en la protección de materiales (p.ej. madera, dispersiones de pinturas, fibras y telas) y en la protección de productos almacenados.

Los compuestos I se aplican, tratando los hongos o las plantas, semillas, materiales o el suelo a proteger frente a una infección fungosa con una cantidad activa fungicida de los ingredientes activos. La aplicación puede efectuarse antes o después de la infección de los materiales, plantas o semillas por los hongos.

Generalmente, las composiciones fungicidas contienen de entre 0,1 y 95, preferentemente, 0,5 y 90% en peso de ingrediente activo.

Cuando se usan en la protección de plantas, las cantidades de aplicación varían de 0,01 a 2,0 kg de ingrediente activo por ha, dependiendo del tipo de efecto deseado.

En el tratamiento de las semillas, las cantidades de ingrediente activo varían, generalmente, de 0,001 a 0,1 g, preferentemente, de 0,01 a 0,05 g, por kilogramo de semilla.

117

En la protección de materiales o de productos almacenados, la cantidad de aplicación de ingrediente activo depende de la naturaleza de la aplicación y del efecto deseado. Las cantidades de aplicación generalmente usados para la protección de materiales varían, por ejemplo, de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, de 0,005 g a 1 kg, de ingrediente activo por metro cúbico del material tratado.

Los compuestos I pueden ser transformados en las formulaciones acostumbradas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. El uso depende del fin respectivo, pero en todo caso debe estar asegurada una dispersión fina y uniforme del compuesto según la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, diluyendo el ingrediente activo con disolventes y/o soportes, en caso de desearlo, usando emulsionantes y dispersantes. Disolventes/auxiliares apropiados son, substancialmente:

agua, disolventes aromáticos (por ejemplo, productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo, metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo, ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (glicol diacetato), glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos. En principio, se pueden usar también mezclas de disolventes.

soportes, como p.ej. minerales molidos naturales (tales como caolines, arcillas, talco, tiza) y minerales



sintéticos molidos (tales como sílice altamente disperso, silicatos); emulsionantes, como p.ej. emulsionantes no iónicos y aniónicos (tales como éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo) y dispersantes, como p.ej. lejías residuales lignino-sulfíticas y metilcelulosa.

Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con formal y formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, tristearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfíticas y y metilcelulosa.

Sustancias apropiadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite directamente pulverizables son: fracciones de aceite mineral de punto de ebullición mediano hasta elevado, como p.ej. keroseno o aceite diesel, además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de

119

origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

Polvos, agentes de pulverización y rociado pueden ser preparados mezclando o moliendo conjuntamente las sustancias activas con un soporte sólido.

Los granulados (p.ej. granulados recubiertos, impregnados o homogéneos) se pueden preparar uniendo el ingrediente activo con un soporte sólido. Ejemplos de cargas sólidas son: tierras minerales, tales como silicagel, ácidos silícicos, geles silícicos, silicatos, talco, caolín, caliza, cal, bol, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, plásticos molidos, así como abonos, tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos vegetales, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras de nueces, polvos de celulosa u otros soportes sólidos.

Generalmente, las formulaciones comprenden de 0,01 a 95% en peso, preferentemente, de 0,1 a 90% en peso del ingrediente activo. Los ingredientes activos se usan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, de 95% a 100% (según espectro de NMR).

Ejemplos de formulaciones son:

120

A Concentrados solubles (SL)

10 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltas en agua o en un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se pueden adicionar humectantes u otros auxiliares. El ingrediente activo se disuelve cuando es diluido con agua.

B Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltas en ciclohexanona adicionando un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión.

C Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltas en xileno adicionando dodecilbencenesulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5% respectivamente). Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión.

D Emulsiones (EW, EO)

40 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltas en xileno adicionando dodecilbencenesulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5% respectivamente). Esta mezcla es introducida en agua por medio de un emulsificante (Ultraturrax) y transformada en una emulsión homogénea. Diluyendo con agua, se obtiene una

emulsión.

E Suspensiones (SC, OD)

En un molino de bolas se trituran 20 partes en peso de un compuesto según la invención adicionando un dispersante, humectante y agua o un disolvente orgánico, obteniéndose una suspensión fina de ingrediente activo. Diluyendo con agua, se obtiene una suspensión estable del ingrediente activo.

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

50 partes en peso de un compuesto según la invención son molidas finamente, adicionando dispersantes y humectantes, y transformadas en granulados dispersables en agua o solubles en agua mediante dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusora, torre de pulverización, lecho fluidizado). Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable del ingrediente activo.

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

75 partes en peso de un compuesto según la invención son molidas en un molino de rotor-estator adicionando dispersante, humectantes y gel de sílice. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable con el ingrediente activo.

2. Productos a ser aplicados sin dilución

H Polvos pulverizables (DP)

5 partes en peso de un compuesto según la invención son molidas finamente y mezcladas íntimamente con 95% de un caolín finamente dividido. Se obtiene un polvo pulverizable.

I Granulados (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de un compuesto según la invención son molidas finamente y asociadas con 95.5% de soporte. Métodos actuales son: extrusión, secado por pulverización y lecho fluidizado. Se obtienen granulados que pueden ser aplicados sin dilución.

J Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

... ..

10 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltas en un disolvente orgánico, por ejemplo, xileno. Se obtiene un producto que puede ser aplicado sin dilución.

Los ingredientes activos pueden ser usados como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas, por ejemplo, como soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite directamente pulverizables, pastas, polvos pulverizables, agente de rociado o de regado. Las formas de aplicación dependen enteramente del fin de aplicación, pero en todo caso hay que asegurar una distribución lo más fina posible de los ingredientes activos según la invención.

Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables, dispersiones de aceite) adicionando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite se pueden homogeneizar las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente en agua con la ayuda de un humectante, agente adherente, dispersante o emulsionante. Alternativamente, se pueden preparar concentrados compuestos de la sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante, en caso dado, disolvente o aceite, y tales concentrados son apropiados para ser diluidos con agua.

Las concentraciones en ingrediente activo en los productos listos para el uso pueden variar ampliamente. En general, varían de 0,0001 a 10%, preferentemente, de 0,01 a 1%.

Los ingredientes activos también pueden ser usado con éxito en el procedimiento de volumen ultrabajo (ULV), pudiéndose aplicar formulaciones con más del 95% en peso de ingrediente activo, o aún el ingrediente activo sin aditivos.

Se pueden adicionar varios tipos de aceite, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, u otros pesticidas o bactericidas a los ingredientes activos, en caso dado, recién antes de la aplicación (mezcla de tanque). Estos agentes pueden ser mezclados con los agentes según la invención en una relación ponderal de 1:10 hasta 10:1.

Cuando se usan como fungicidas, las composiciones de la invención pueden estar presentes también junto con otros

ingredientes activos, por ejemplo, con herbicidas, insecticidas, reguladores del crecimiento, fungicidas u otros fertilizantes. Cuando se mezclan los compuestos I o las composiciones según la invención como fungicidas con otros fungicidas, entonces se alcanza, frecuentemente, ampliar el espectro de acción.

La siguiente lista de fungicidas con los que se pueden mezclar los compuestos según la invención sirve para ilustrar las combinaciones posibles, pero no debe entenderse como limitativa:

- acilalaninas, tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo,
- derivados de amina, tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidín, guazatina, iminocadina, spiroxamin, tridemorf
- anilino pirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirim o cyrodinilo,
- antibióticos, como p.ej. cicloheximida, griseofulvin, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomycin,
- azoles, como p.ej. bitertanol, bromoconazol, cyproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazole imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol,
- dicarboximidas, como p.ej. iprodiona, miclozolina, procymidona, vinclozolina,

PF 54041

- ditiocarbamatos, como p.ej. ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos, como p.ej. anilacina, benomilo, boscalida, carbendazim, carboxin, oxicarboxin, cyazofamid, dazomet, ditianona, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mepronilo, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilon, quinoxifen, siltiofam, tiabendazol, thifluzamid, tiofanato-metilo, tiadinilo, tricyclazol, triforina,
- fungicidas de cobre, como p.ej. mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, como p.ej. binapacrilo, dinocap, dinobuton, nitroftal:isopropilo
- fenilpirroles, como p.ej. fenpiclonilo o fludioxonilo,
- azufre
- otros fungicidas, como p.ej. acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamid, clorothalonilo, cyflufenamid, cymoxanilo, dazomet, diclomezin, diclocymet, dietofencarb, edifenphos, etaboxam, fenhexamid, fentin-acetate, fenoxanilo, ferimzone, fluacinam, fosetilo, fosetil-aluminum, iprovalicarb, hexaclorobenzene, metrafenon, pencycuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-metilo, quintozone, zoxamid
- estrobilurinas, como p.ej. azoxistrobin, dimoxistrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, oysastrobin, picoxistrobin, piraclostrobin o trifloxistrobin,

- derivados de ácido sulfúrico, como p.ej. captafol, captan, dichlofluanid, folpet, tolilfluanid
- cinemamidas y análogos, como p.ej. dimetomorf, flumetover o flumorf.

Ejemplos de síntesis

Variando en forma correspondiente los compuestos de partida, los protocolos prepresentados en los ejemplos de síntesis siguientes fueron usados para obtener otros compuestos I. Los resultantes compuestos I, junto con los datos físicos están relacionados en la siguiente Tabla I.

Ejemplo 1 Obtención de éster etílico del ácido 2-ciclopentil-3-oxobutílico

Una mezcla de éster etílico de ácido 3-oxobutílico (0,5 moles), bromuro de ciclopentilo (0,5 moles) y etoxilato de sodio (0,5 moles) en etanol (100 ml) se calentaron durante 15 horas a reflujo. Después de enfriar la mezcla de reacción a aprox. 20 a 25°C se aislaron 71g del compuesto indicado en el título por destilación (96-100°C, 0,25 mbar).

Ejemplo 2 Obtención de 5-metil-6-ciclopentil-7-hidroxil-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina

Una mezcla de 3-amino-1,2,4-triazol (14 g), éster etílico de ácido 2-ciclopentil-3-oxobutílico (0,17 moles, Ej. 1) y tributilamina (50 ml) se calentaron durante 6 horas a 180°C. Después de enfriar la mezcla de reacción a aprox. 70°C se agregó agua, solución acuosa de NaOH (21g en 200 ml de H₂O) y

se agitó la solución otros 30 min. Después de la separación de las fases y extracción con éter dietílico, se aciduló la fase acuosa con solución concentrada de HCl. A partir del precipitado se obtuvieron 19 g del compuesto indicado en el título.

**Ejemplo 3 Obtención de 5-metil-6-ciclopentil-7-cloro-
[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina**

Una mezcla de 5-metil-6-ciclopentil-7-hidroxi-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pirimidina (17 g, Ej. 2) y POCl₃ (50 ml) fueron calentados durante 8 horas a reflujo, destilándose una parte del POCl₃ ab. El residuo se vertió en una mezcla de diclorometano/agua. La fase orgánica se separó y se secó. Después de separar el disolvente se obtuvieron 11g del compuesto indicado en el título de p.p. 87°C.

**Ejemplo 4 Obtención de 5-metil-6-ciclopentilo-7-(4-
metilpiperidina-1-il)-[1,2,4]-triazolo[1,5-
a]pirimidina [I-1]**

Una solución de 4-metilpiperidina (1,5 mmoles) y trietilamina (1,5 mmoles) en 10ml de diclorometano se agregaron bajo agitación a una solución de 5-metil-6-ciclopentil-7-cloro-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina (1,5 mmoles, Ej. 3) en 20ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó durante aprox. 16 horas a 20 hasta 25°C, luego se lavó con solución al 5% de HCl. La fase orgánica se separó y se secó. Después de haber destilado el disolvente y purificado por cromatografía en silicagel, se obtuvieron 0,26g del compuesto indicado en el

título del p.f. 145°C.

Tabla I: Compuestos de la fórmula I

No.	R ¹	R ¹	R ²	X	Datos físicos (p.f. [°C], IR [cm ⁻¹])
I-1	-(CH ₂) ₄ CH(CH ₃)(CH ₃)-		ciclopentilo	CH ₃	145
I-2	(R) CH(CH ₃)- CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	CH ₃	96
I-3	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	CH ₃	108
I-4	H	H	ciclopentilo	CH ₃	271
I-5	CH ₃	H	ciclopentilo	CH ₃	175
I-6	(R) CH(CH ₃)- C(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	CH ₃	1960; 1605; 1590; 1240

Ejemplos para la acción contra hongos nocivos

La acción fungicida de los compuestos de la fórmula I puede ser demostrada en los siguientes experimentos:

Los ingredientes activos se usaron separada o conjuntamente para preparar una solución madre, que comprende 0.25% en peso del ingrediente activo en acetona o DMSO. Se adicionó 1% en peso del emulsionante Uniperol® EL (humectante de efecto emulsionante y dispersante con base en alquilfenoles

etoxilados) a esta solución, y la mezcla fue diluida con agua a la concentración deseada.

Ejemplo 1: Eficiencia contra la marchitez temprana del tomate causada por *Alternaria solani*

Las hojas de plantas de tomate crecidas en macetas de la variedad: "Große Fleischtomate St. Pierre" fueron pulverizadas con una suspensión acuosa, que contiene el compuesto activo en la concentración abajo mencionada. El día siguiente, se infectaron las hojas con una suspensión de zoosporas de *Alternaria solani* (0.17×10^6 esporas por ml de una solución de biomalta al 2%). Entonces se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a 20 hasta 22°C. Después de 5 días, la enfermedad se había extendida en un grado tal sobre las plantas no tratadas, que se podía evaluar la actividad fungicida de las sustancias.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm del ingrediente activo I-1 no presentaban ninguna infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en un 90%.

Ejemplo 2: Eficiencia contra la podredumbre ácida en hojas de pimiento causada por *Botrytis cinerea* en la aplicación protectora

Plántulas de pimiento fueron pulverizadas hasta chorrear en el estadio de las cuatro a cinco hojas con una suspensión acuosa, que contiene la concentración en ingrediente activo abajo indicada. El día siguiente se inocularon las plantas con una



suspensión de esporas de *Botrytis cinerea*, que contiene 1.7×10^6 esporas por ml en solución acuosa de biomalta al 2% en peso. Las plantas infectadas se incubaron, luego, durante cinco días a 22-24°C en cámaras con alta humedad. La extensión del desarrollo del hongo fue evaluado en %, con respecto a la superficie total de la hoja.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los ingredientes activos I-1, o bien I-3 estaban infectada en, como máximo, un 20%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en un 90%.

Ejemplo 3 - Eficiencia contra el oídio en hojas de pepinos causado por *Sphaerotheca fuliginea* en la aplicación protectora

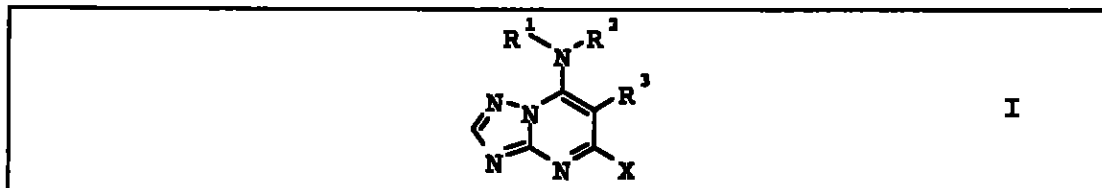
La hojas de plántulas de pepino crecidas en macetas de la variedad "Chinesische Schlange" se pulverizaron hasta chorrear en el estadio de las hojas cotiledóneas con una suspensión acuosa, que contenía la concentración en ingrediente activo indicada. 20 horas después de estar seca la capa pulverizada se inocularon las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea*. A continuación, se cultivaron las plantas en el invernadero a temperaturas de entre 20 y 24°C y 60 a 80% de humedad relativa del aire. A continuación, se determinó la extensión del desarrollo del oídio visualmente en % de infección de la superficie de hoja cotiledónea.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los ingredientes activos I-1, o bien I-3 estaban infectadas en un 3%, como máximo, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en un 90%.

131

Reivindicaciones

1. 5-Alquil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I,



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R^1, R^2 significan hidrógeno, alquilo- C_1-C_{10} , alquenilo- C_1-C_{10} , alquinilo- C_1-C_{10} , haloalquilo- C_1-C_{10} , cicloalquilo- C_3-C_6 , fenilo, naftilo; o

heterociclilo saturado, no saturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno; o

R^1 y R^2 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, que los une, un anillo con 5 ó 6 miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno;

R^1 y R^2 , si no significan hidrógeno, pueden estar, independientemente, parcial o completamente halogenados y/o llevar uno a tres radicales del grupo R^1

/32

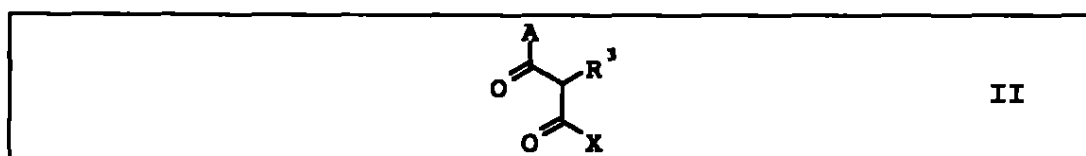
R^1 es ciano, nitro, hidroxilo, alquilo- C_1-C_6 , haloalquilo- C_1-C_6 , cicloalquilo- C_3-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 , haloalcoxi- C_1-C_6 , alquiltio- C_1-C_6 , alquilamino- C_1-C_6 , di-alquilamino- C_1-C_6 , alquenilo- C_2-C_6 , alqueniloxi- C_2-C_6 , alquinilo- C_2-C_6 , alquiniloxi- C_2-C_6 y oxi-alquilenoxi- C_1-C_6 , opcionalmente halogenado;

R^2 significa cicloalquilo- C_3-C_{10} o bicicloalquilo- C_6-C_{10} , pudiendo R^2 estar no sustituido o parcial o completamente halogenado y/o llevar de uno a tres radicales del grupo R^1 ; y

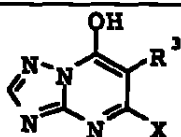
X significa alquilo- C_1-C_6 ;

y sus sales.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en donde X significa metilo.
3. Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, caracterizado porque se ciclizan compuestos de dicarbonilo de la fórmula II

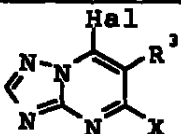


en la que A significa alcoxi- C_1-C_{10} y R^2 y X tienen las definiciones indicadas para la fórmula I, con 3-amino-1,2,4-triazol en 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula III



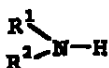
III

y se halogenan III con un agente de halogenación en 7-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula IV



IV

donde Hal significa halógeno, y luego se transforman estas con una amina de la fórmula V



V

donde R¹ y R² tienen las definiciones indicadas para la fórmula I, dando 5-alkil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I.

4. Compuestos de las fórmulas III y IV, que tienen las definiciones indicadas en la reivindicación 3.
5. Productos apropiados para combatir hongos fitopatógenos, que contienen un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.
6. Uso de compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 para la obtención de un producto para combatir hongos

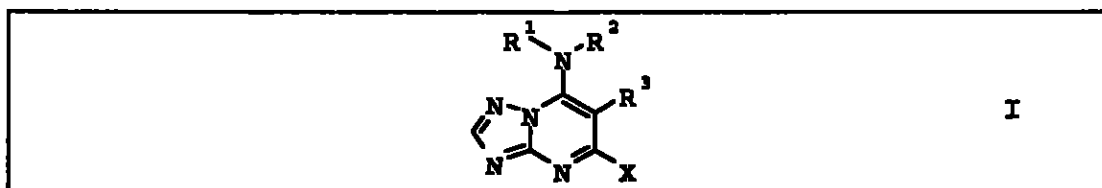
nocivos.

7. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a una infección por los hongos, con una cantidad activa de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1.

5-alkil-7-aminotriazolopirimidinas, procedimientos y productos intermedios para su obtención, productos que las contienen y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos

Resumen

5-Alquil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I,



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R^1, R^2 significan hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, cicloalquilo, fenilo, naftilo; o heterociclilo saturado, no saturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno; o

• R^1 y R^2 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, que los une, un anillo con 5 ó 6 miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno;

R^3 significa cicloalquilo o bicicloalquilo;

pudiendo R¹, R² y R³ estar sustituidos en la forma indicada en la descripción;

X significa alquilo;

y sus sales;

procedimientos y productos intermedios para su obtención, productos que las contienen y el uso de las mismas para combatir hongos fitopatógenos.

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Calle 10 No. 10-10, San José, Costa Rica

137

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

Observaciones: *Art Final*

128

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Radicación - 8483427 44000000 Folios: 138
Fecha (MM): 05-05-02 16:59:19
Trasite : 011 PAT-PATENT 779 FASE NACI 411 PRESENTA
Referencia: 2020 AUTORIZA DE NUEVAS PRESENTACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 35.939
FECHA : MAYO 16 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	40116714	16/05/2005	39,471,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. Cdo 00361-841-044-6

SECRETARÍA DE ECONOMÍA
Radicación: 07053023 00000000 Folios: 138
Fecha (DMM): 2005-05-02 16:59:19
Trámite: 011 OCT-PATENT 729 FOMF MARZ 411 DEFENSOR
Inspección: PARA AUTORIZACIÓN DE NUEVOS REPRESENTANTES

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
- Descripción de la invención.	()	()
- Dibujos de ser estos pertinentes.	()	()
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()

COMPLETA	()	INCOMPLETA	()
-----------------	-----	-------------------	-----

DISEÑO INDUSTRIAL	()		
- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()	
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	()	()	
- Representación gráfica o fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	()	()	
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()	
COMPLETA	()	INCOMPLETA	()

ESQUEMA DE TRAZADO	()		
- Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	()	()	
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	()	()	
- Representación gráfica del esquema de trazado	()	()	
- Comprobante de pago de las tasas establecidas.	()	()	
COMPLETA	()	INCOMPLETA	()

Firma Responsable: 

Fecha:

NU



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor:
EMILIO FERRERO
Apoderado
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Oficio N° 05698

ASUNTO:	Radicación N°	05-53823
	Solicitud internacional	PCT/EP2003/012277
	Fecha inicio fase nacional	07/06/2005
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Folios	001

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

- El solicitante debe aclarar la traducción del capítulo reivindicatorio, ya que el original presenta inicialmente nueve (9) reivindicaciones, y la traducción referida solamente siete (7) reivindicaciones.

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

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


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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha, 8 JUL 2005

202030

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Commutador: 534 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

10/01/05
N

0

0