

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72-35
BOGOTÁ, COLOMBIA

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 211-8650 (57) (1) 540-0860

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 0565.823 00000002 Folios: 47
Fecha (MM): 2005-09-06 17:14:04
Trámite : 011 PET-PATENT 379 FASE NCI 444 RESPUESTA
Dependencia: 2005 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación: 444

Referencia : Expediente No. 05.053.823
Solicitante : BASF AKTIENGESSELLSCHAFT
Asunto : Solicitud de patente para "5-ALQUIL-7-AMINOTRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS Y PRODUCTOS INTERMEDIOS PARA SU OBTENCION, PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN Y USOS DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS"

Fecha de la solicitud : 2 de Junio de 2005

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al oficio número 05698; notificado por fijación en lista del 8 de julio de 2005.

2. Mediante el oficio número 05698 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. Traducción de las reivindicaciones.

Presento nueva traducción al español de las reivindicaciones de la presente solicitud de patente, donde se establece el número correcto de

reivindicaciones siendo estas 9 en total, tal y como aparece en la solicitud internacional original.

Adicionalmente, con el fin de hacer claridad respecto a la traducción de la descripción original, presento igualmente una nueva traducción del capítulo descriptivo que corresponde al texto en alemán de la solicitud internacional.

3. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá, 6 SET. 2005
Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

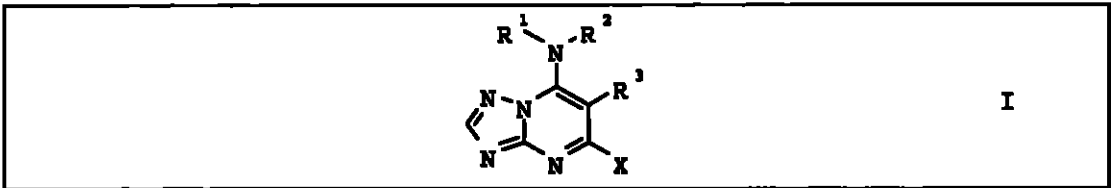
 COLO 00361-841-049-6
MRE/ZCA/
ID-004187/WPCL0361

W3

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

5 Descripción

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



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10

R¹, R² significan hidrógeno, alquilo-C₁-C₁₀, alquenilo-C₂-C₁₀, alquinilo-C₂-C₁₀, haloalquilo-C₁-C₁₀, cicloalquilo-C₃-C₈, fenilo, naftilo; o

15

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

20

R¹ y R² 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;

25

R³ y R⁴, si no significan hidrógeno, pueden estar, independientemente, parcial o completamente halogenados y/o llevar uno a tres radicales del grupo R⁵
R⁵ es ciano, nitro, hidroxilo, alquilo-C₁-C₈, haloalquilo-C₁-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈, alcoxi-C₁-C₈, haloalcoxi-C₁-C₈, alquiltio-C₁-C₈, alquilamino-C₁-C₈, di-

114

alquilamino-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alqueniloxi-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alquiniloxi-C₃-C₆ y oxi-alquilenoxi-C₁-C₄ opcionalmente halogenado;

pudiendo estos grupos alifáticos o alicíclicos a su vez estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^b:

R^b significa halógeno, clano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halogenaalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, pudiendo los grupos alquilo en estos radicales contener 1 a 6 átomos de carbono y pudiendo los mencionados grupos alquenilo o alquinilo en estos radicales contener 2 a 8 átomos de carbono;

y/o uno a tres de los siguientes radicales:

cicloalquilo, cicloaalcoxi, heterociclilo, heterociciloxi, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros de anillo; arilo, ariloxi, ariltio, aril-C₁-C₆-alcoxi, aril-C₁-C₆-alquilo, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10 miembros de anillo, los radicales hetarilo contener 5 ó 6 miembros de anillo, cuyos sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo;

R^s significa cicloalquilo-C₃-C₁₄ o bicicloalquilo-C₆-C₁₄, pudiendo R^s estar no sustituido o parcial o completamente halogenado y/o llevar de uno a tres radicales del grupo R^a;

MS

y

X significa alquilo-C₁-C₆ o haloalquilo-C₁-C₂
y sus sales.

5

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.

10 6-aryl-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-aryl- y 6-arylalquil-7-aminotriazolopirimidinas, que pueden llevar un radical alquilo en la posición 5. 6-Cicloalquiltriazolopirimidinas con diversos radicales en la posición 5 se
15 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.

20

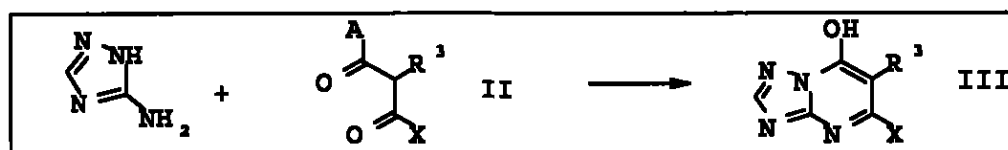
Sin embargo, su efecto es insatisfactorio en muchos casos, por lo que existió la tarea de encontrar compuestos con eficiencia mejorada.

Por tanto, se encontraron las 5-alquil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I. Además, se
25 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 R³, que es un grupo cicloalquilo mono o bicíclico, en el esqueleto de triazolopirimidina.

- 5 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 R³ y X tienen las definiciones indicadas en la fórmula I, dando 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula III:

10



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].

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

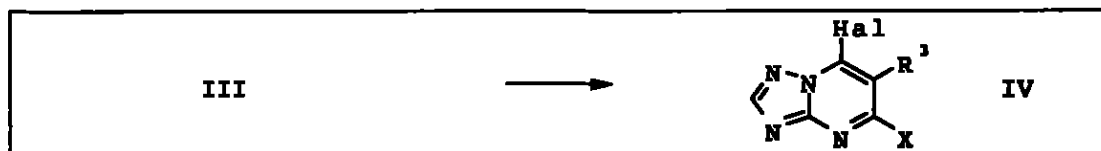
- 20 Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también es posible usarlas en cantidad equimolar, en exceso o, opcionalmente, como disolvente.

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.

- 25 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 [heterocicl. 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:

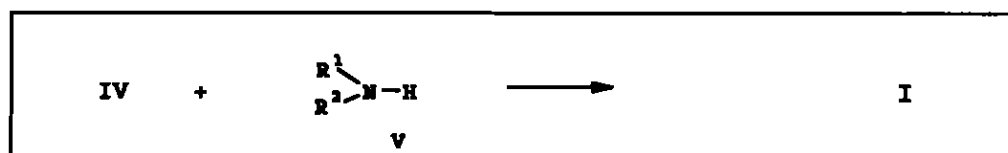


Esta reacción se efectúa, generalmente, a temperaturas de 0°C a 150°C, preferentemente, 80°C a 125°C, en un disolvente orgánico Inerte o sin disolvente [ver EP-A-770 615].

Como agente de halogenación se usan, preferentemente, agentes de bromación o cloración, tales como oxibromuro fosfórico o oxidloruro 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.

5

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 alquillos 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.

20

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 sí 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 no 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 R³ tienen los significados indicados para la fórmula I, y Hal significa halógeno, especialmente, cloro o bromo, son nuevas.

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: 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-metilpropilo, 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-C₂, 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-tricloroetilo, y pentafluoroetilo;

5 **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- C_2-C_6 , 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, 10 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;

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;

5

cicloalquilo: grupos hidrocarburo monocíclicos, saturados con 3 a 5, 6 ó 8 miembros anulares de carbono, p.ej. cicloalquilo-C₃-C₈, como p.ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo;

10 **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
 15 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-tetrahidrofurano, 3-tetrahidrofurano, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-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-
 20 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-tetrahidropirano, 4-tetrahidropirano, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridacnilo, 4-hexahidropiridacnilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo y 2-piperacnilo;

25

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

10

heteroarilo de seis miembros, (heterociclillo 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-piridacnilo, 4-piridacnilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-piracnilo;

15

oxaliquilenoxi: 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 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$;

20

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.

25

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 deseárselo, uno a cuatro átomos de hidrógeno estar sustituidos por alquilo-C₁-C₄, hidroxi-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-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.

10 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.

15

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

20 Las variantes especialmente preferidas de los productos intermedios en cuanto a las variables corresponden a aquellas de los radicales R³ y X de la fórmula I.

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

25

Son preferidos los compuestos I, en los que R¹ y R² significan hidrógeno, alquilo-C₁-C₁₀, o haloalquilo-C₁-C₆, especialmente, hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, 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. pirrolidin-1-ilo, pirrol-1-ilo, pirazol-1-ilo, imidazol-1-ilo, piperidin-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 R^a, 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-metilpiperidin-1-ilo.

10

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 hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, o haloalquilo-C₁-C₄, y R² es hidrógeno o alquilo-C₁-C₄, especialmente, hidrógeno.

15

Además, son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ y R² no llevan grupos R^b, especialmente, aquellos en los que R¹ y R² no llevan grupos R^a.

Otro objeto preferido son compuesto I, en los que R¹ y R² significan hidrógeno.

20

Son muy especialmente preferidos los compuestos I, en los que R³ significa cicloalquilo-C₃-C₁₂; preferentemente, ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo, ciclooctilo o ciclododecilo o bicicloheptilo, donde R³ puede llevar uno a tres grupos R^a. Especialmente, R³ no es sustituido.

25

Además, son especialmente preferidos los compuestos I, en los que X significa alquilo-C₁-C₄, especialmente, metilo.

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.

5

Tabla 1

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

25

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

5

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

25

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa ciclohexilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa ciclohexilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 12

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa ciclohexilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 13

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa cicloheptilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa cicloheptilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

5

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

25

Tabla 20

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

5

Tabla 21

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 22

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

25

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

5

Tabla 26

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10 · **Tabla 27**

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15 **Tabla 28**

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ significa biciclo[2.2.1]hept-2-ilo, X significa isopropilo, y la combinación de los radicales R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20 **Tabla 29**

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa 2-metilciclopentilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 31

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa 2-metilciclopentilo, X significa n-propilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 32

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa 2-metilciclopentilo, X significa iso-propilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 33

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa 3-metilciclopentilo, X significa metilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 34

Compuestos de la fórmula I, en los que R^3 significa 3-metilciclopentilo, X significa etilo, y la combinación de los radicales R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 35

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

5

Tabla 36

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 37

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

Tabla 39

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

25

Tabla 40

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

5

Tabla 41

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 42

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

15

Tabla 43

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

Tabla 44

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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 R³ 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

5

Tabla 46

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

10

Tabla 47

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

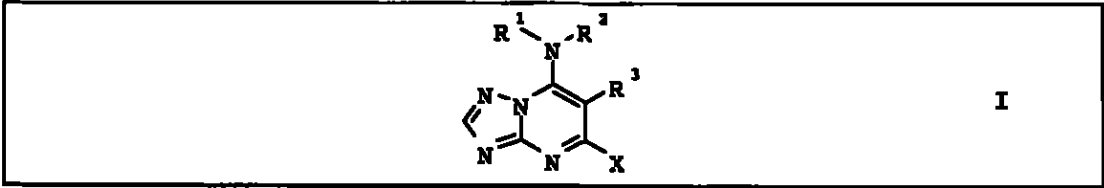
15

Tabla 48

Compuestos de la fórmula I, en los que R³ 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

20

25 Tabla A



No.	R ¹	R ²
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
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

167

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
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	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$
A-81	$-(\text{CH}_2)_5-$
A-82	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$
A-83	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$
A-84	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$
A-85	$-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2-$
A-86	$-(\text{CH}_2)_2\text{CHF}(\text{CH}_2)_2-$
A-87	$-(\text{CH}_2)_3\text{CHFCH}_2-$
A-88	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CF}_3)(\text{CH}_2)_2-$
A-89	$-(\text{CH}_2)_2\text{O}(\text{CH}_2)_2-$
A-90	$-(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{CH}_2)_2-$
A-91	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$

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

5 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,

10 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:

- 15 · especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
- especies de *Bipolaris* y *Drechslera* en cereales, arroz y césped,

- *Blumeria graminis* (mildú) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (oldio) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- especies de *Fusarium* y *Verticillium* en diferentes plantas,
- 5 · especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y mani,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Plasmopara viticola* en vid,
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- 10 · 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,
- 15 · *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.

- 20 *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
- 25 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.

5 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.

10 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.

15

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.

20

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:

25

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.

- 10 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 fenol 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 alquilicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfíticas 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 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 o

agua.

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

5

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.

10

15 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:

20 1. Productos para la dilución con agua

A Concentrados solubles (SL)

10 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltos 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.

25

B Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltos en ciclohexanona

adicionando un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. diluyendo con agua, se obtiene una dispersión.

C Concentrados emulsionables (EC)

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

D Emulsiones (EW, EO)

10 40 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltos en xileno adicionando dodecibencenesulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5% respectivamente). Esta mezcla es introducida en agua por medio de un emulsificante (Ultraturax) y transformada en una emulsión homogénea. diluyendo con agua, se obtiene una emulsión.

15

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
20 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 molidos finamente, adicionando dispersantes y humectantes, y transformadas en granulados dispersables
25 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 molidos 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.

5

2. Productos a ser aplicados sin dilución

H Polvos pulverizables (DP)

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

10

I Granulados (GR, FG, GG, MG)

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

15

J Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

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

20

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

25

una distribución lo más fina posible del 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 l 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, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf
- 10 · anilino pirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirim o ciprodinilo,
- antibióticos, como p.ej. cicloheximida, griseofulvin, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomina,
- azoles, como p.ej. bitertanol, bromoconazol, cyproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol,
- 15 · imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, trífumizol, tríticonazol,
- dicarboximidas, como p.ej. iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,
- ditiocarbamatos, como p.ej. ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb,
- 20 · compuestos heterocíclicos, como p.ej. anilacina, benomilo, boscalida, carbendazim, carboxina, oxicarboxina, clazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotilano, mepronilo, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirfenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tífuzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, tríciclazol, triforina,
- 25 · fungicidas de cobre, como p.ej. caldo de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, como p.ej. binapacril, dinocap, dinobutona, nitroftalisopropilo
- fenilpirroles, como p.ej. fenpiclonilo o fludioxonilo,

- **azufre**
- **otros fungicidas, como p.ej. acibencenoar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, cflufenamida, cimoxanilo, dazomet, dclomecina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, ferimzona, fluacinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenon, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida**
- **estrobilurinas, como p.ej. azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,**
- **derivados de ácido sulfúrico, como p.ej. captafol, captan, diclofluanida, folpet, tolilfluanida,**
- **amidas de ácido cinámico 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.

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 (98-100°C, 0,25 mbar).

**Ejemplo 2 Obtención de 5-metil-6-ciclopentil-7-hidroxi- [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
5 (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.

10

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
15 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.f. 87°C.

**Ejemplo 4 Obtención de 5-metil-6-ciclopentilo-7-(4-metilpiperidina-1-Il)-[1,2,4]-
20 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
25 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 ²	R ³	X	Datos físicos (p.f.[°C]; IR [cm ⁻¹])
I-1	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		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) ₃	H	ciclopentilo	CH ₃	1960; 1605; 1590; 1240

5

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

10

15

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.

- 10 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 pimienta causada por *Botrytis cinerea* en la aplicación protectora

15

Plántulas de pimienta 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.

20

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%.

25

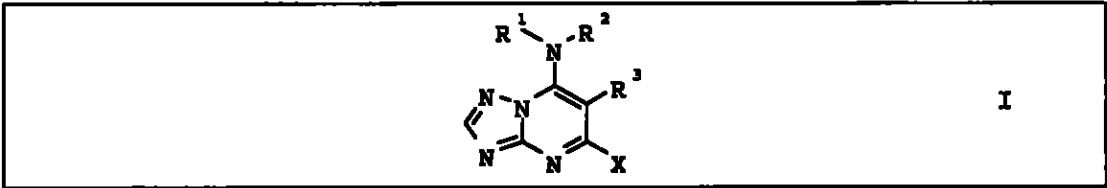
Ejemplo 3 - Eficiencia contra el óidio en hojas de pepinos causado por *Sphaerotheca fuliginea* en la aplicación protectora

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 óidio 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%.

Reivindicaciones

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



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹,R² significan hidrógeno, alquilo-C₁-C₁₀, alquenilo-C₂-C₁₀, alquinilo-C₂-C₁₀, haloalquilo-C₁-C₁₀, cicloalquilo-C₃-C₈, 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

R¹ y R² 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;

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

R^a es clano, nitró, hidroxi, 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-C₂-C₆, alqueniloxi-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alquiniloxi-C₃-C₆ y oxi-alquilenoxi-C₁-C₄ opcionalmente halogenado;

pudiendo estos grupos alifáticos o alicíclicos a su vez estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^b :

5 R^b significa halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halogenalcóxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcóxicarbonilo, alquilcarboniloxi, 10 alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, pudiendo los grupos alquilo en estos radicales contener 1 a 6 átomos de carbono y pudiendo los mencionados grupos alquenilo o alquinilo en estos radicales contener 2 a 8 átomos de carbono;

15 y/o uno a tres de los siguientes radicales:

cicloalquilo, cicloalcóxi, heterociclilo, heterociciloxi, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros de anillo; arilo, ariloxi, 20 ariltio, $\text{aril-C}_1\text{-C}_6\text{-alcóxi}$, $\text{aril-C}_1\text{-C}_6\text{-alquilo}$, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10 miembros de anillo, los radicales hetarilo contener 5 ó 6 miembros de anillo, cuyos sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o 25 haloalquilo;

R^3 significa cicloalquilo- $\text{C}_3\text{-C}_{14}$ o bicicloalquilo- $\text{C}_6\text{-C}_{14}$, pudiendo R^3 estar no sustituido o parcial o completamente halogenado y/o llevar de uno a tres

radicales del grupo R^a; y

X significa alquilo-C₁-C₆ o haloalquilo-C₁-C₂

5 y sus sales.

2. 5-Alquil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I según la reivindicación 1, donde los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10 R¹, R² significan hidrógeno, alquilo-C₁-C₁₀, alqueno-C₂-C₁₀, alquino-C₂-C₁₀, haloalquilo-C₁-C₁₀, cicloalquilo-C₃-C₈, 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

15

R¹ y R² 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;

20

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

25 R^a es ciano, nitro, hidroxilo, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₈, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilamino-C₁-C₆, dialquilamino-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆, alqueno-C₂-C₆, alquino-C₂-C₆, alquinoxio-C₃-C₆ y oxoalqueno-C₁-C₄ opcionalmente halogenado;

R^3 significa cicloalquilo- C_3-C_{14} o bicioalquilo- C_6-C_{14} , pudiendo R^3 estar no sustituido o parcial o completamente halogenado y/o llevar de uno a tres radicales del grupo R^2 ; y

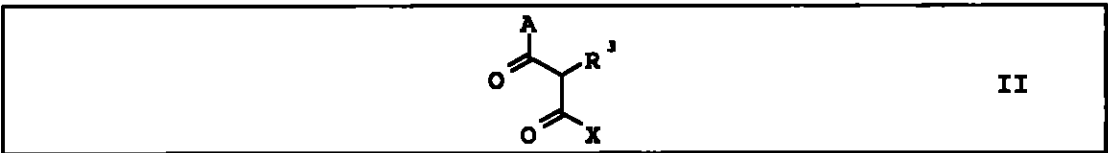
5 X significa alquilo- C_1-C_6

así como sus sales.

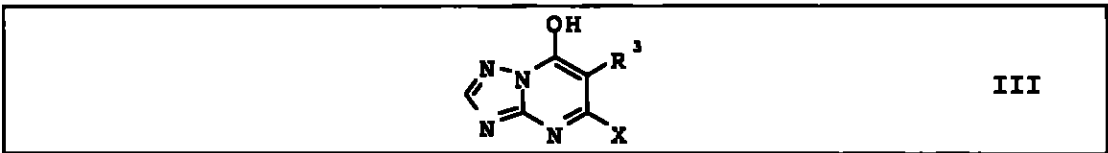
3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en donde X significa metilo.

10

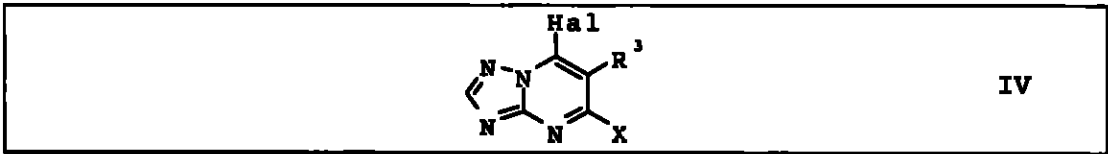
4. Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, caracterizado porque se ciclizan compuestos de dicarbonilo de la fórmula II



15 en la que A significa alcoxi- C_1-C_{10} y R^3 y X tienen las definiciones indicadas para la fórmula I, con 3-amino-1,2,4-triazol en 7-hidroxitriazoloprimidinas de la fórmula III

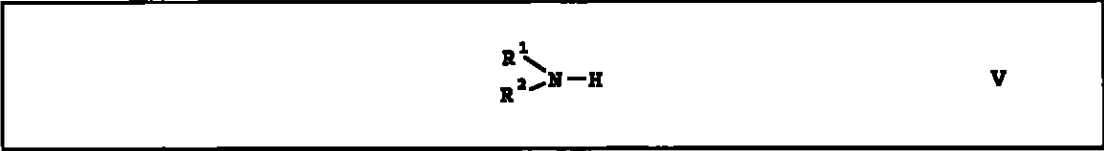


20 y se halogena III con un agente de halogenación en 7-halógenotriazoloprimidinas de la fórmula IV



486

donde Hal significa halógeno, y luego se transforman estas con una amina de la fórmula V



donde R¹ y R² tienen las definiciones indicadas para la fórmula I, dando 5-alkuil-7-aminotriazolopirimidinas de la fórmula I.

5. Compuestos de las fórmulas III y IV, que tienen las definiciones indicadas en la reivindicación 4.

6. Productos apropiados para combatir hongos fitopatógenos, que contienen un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

7. Semillas, que contienen un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1 en una cantidad de 0,001 a 1 g/kg.

8. Uso de compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 para la obtención de un producto para combatir hongos nocivos.

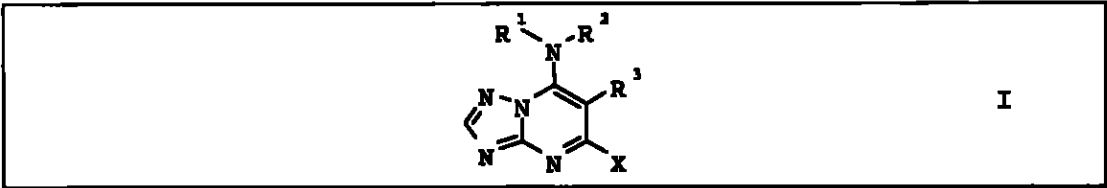
9. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a una infección por los hongos, con una cantidad activa de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1.

NP-7

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



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹,R² 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

R¹ y R² 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;

R³ 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.

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Folio 188

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	05 53823
	Solicitud internacional	EP2003/012277
	Fecha inicio fase nacional	07/06/2005
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	1183
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

13 SET. 2008

ALIX CARMENEA CERPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa10

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-053823

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

PCT FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 570

DE FECHA 30 DE NOVIEMBRE DEL 2006, EL TERMINO HABIL SEÑALADO

POR LA LEY EXPIRA EL 01 DE MARZO DEL 2007

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI ☐ ☐

NO ☐ ☒ ☐

Bogotá D.C., Junio de 2007