



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

05-111856

54. TITULO

7-ALQUILAMINO-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU
OBTENCION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA CONTROLAR HONGOS
NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE LOS CONTIENEN

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

Ludwigshafen, República Federal de Alemania,

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438,019 de Usaquén,

22. BOGOTA, D.C.,



PETITORIO

Radicación : 05111836 00000000
Fecha (REC): 2005-11-02 17:44:54
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 111 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

- 1

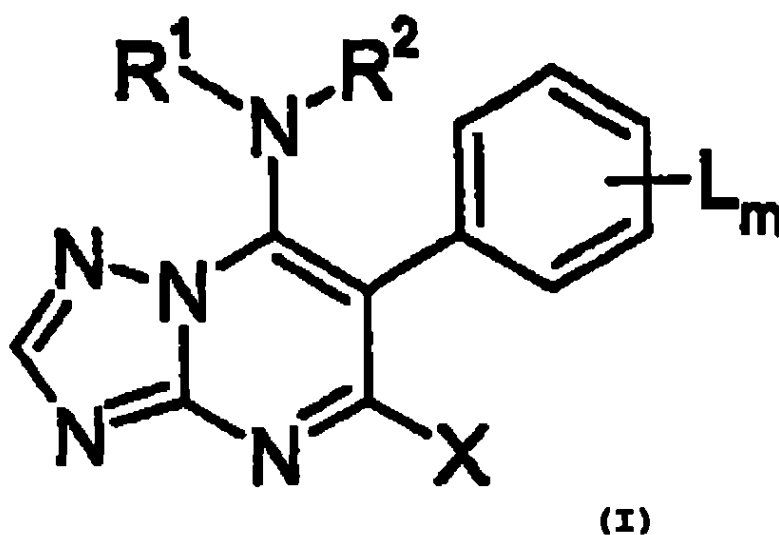
☒ Patente de Invención.
☐ Capítulo I.
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☒ Capítulo II.

2 SOLICITANTE (71)	Nombre: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT sociedad constituida y existente bajo las leyes de: República Federal de Alemania Dirección: Carl-Bosch-Straße 67056 Ludwigshafen, República Federal de Alemania Domicilio: Ludwigshafen, República Federal de Alemania	IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 38 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@camyp.com Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ C.E. ☐ NIT ☐ Otro ☐ Cual _____ Número 438.019 T.P 31.929
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Jordi TORMO I BLASCO Karl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach, República Federal de Alemania 2. Carsten BLETNER Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim, República Federal de Alemania 3. Bernd MÜLLER Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, República Federal de Alemania 4. Markus GEWEHR Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, República Federal de Alemania 5. Wassilios GRAMMENOS Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, República Federal de Alemania 6. Thomas GROTE Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, República Federal de Alemania 7. Andreas GYPSE B4.4, 68159 Mannheim, República Federal de Alemania 8. Joachim RHEINHEIMER Merziger Strasse.24, 67063 Ludwigshafen, República Federal de Alemania	9. Peter SCHÄFER Römerstrasse. 1, 67308 Otterheim República Federal de Alemania 10. Frank SCHIEWECK Lindenweg 4, 67258 Hessheim, República Federal de Alemania 11. Anja SCHWÖGLER Heinrich-Lanz-Strasse. 3, 68165 Mannheim República Federal de Alemania 12. Maria SCHERER Hermann-Jürgens-Strasse.30, 76829 Landau República Federal de Alemania 13. Siegfried STRATHMANN Donnersbergstrasse. 9, 67117 Limburgerhof República Federal de Alemania 14. Ulrich SCHÖFL Erlenstr. 8, 68782 Brühl, República Federal de Alemania 15. Reinhard STIERL Jahnstrasse.8, 67251 Freinsheim, República Federal de Alemania

5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/003346</u> Fecha: <u>30 de marzo de 2004</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2004/087706 A1</u> Fecha: <u>14 de octubre de 2004</u>		
6	TÍTULO (54) <u>7- ALQUILAMINO-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU OBTENCION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA CONTROLAR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE LOS CONTIENEN</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 487/04</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>DE</u>	(32) Fecha <u>02/04/2003</u>
			(31) Número de Solicitud <u>103 14 930.9</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>05 – 83,443</u> Fecha: <u>1 de noviembre de 2005</u>		
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

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2004/087706 A1

Descripción:

Páginas 25 en el idioma original

Páginas 33 en español

Reivindicaciones: Número (s) 8

Figuras: Número (s)

2. ☒ Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (a)
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. 11518; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1º del Artículo 543 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 reemplazará 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 emblemas; 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, transcribir, 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

ppa. Welzel

Unterschrift
 ppa. Richters

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

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)
BASF Aktiengesellschaft
 wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11518; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 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 Fälle der Hauptvertreter, oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung ausüben 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, beziehungsweise, werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Ausserdem, und unter denselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälten, Notaren, und anderen den Schutz meines (unseres) Geschäfts, und das zu erhalten, und gegen das Verstoßen zu verfahren, in dem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne (n), damit sie vor beliebigen Institutionen oder Personen, die als Rechtsprechung über, oder nicht, vor allem vorgehen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Marken und Zeichnungen; Registrierung von Waren, Handelsnamen, Defensive- und Servicezeichen; Ausübung von Handelsnamen und -zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Name- und Wohnortänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragssens; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorrechtsmassnahmen, 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, verrichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterschrift heute am 17. März 1989

in D-6700 Ludwigshafen



U.R.Nr. 1407/89

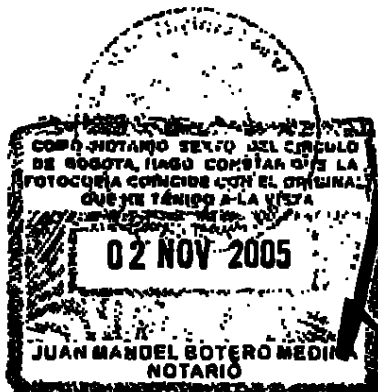
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorst.
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren:

1. Dr. Günther W e i ß 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 be-
scheinige 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]

Tr. Walter
als amtlich bestellter Vertreter
des Notars Dr. Justizrat Dr. Kohler

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 of Franz Serfas]

(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM

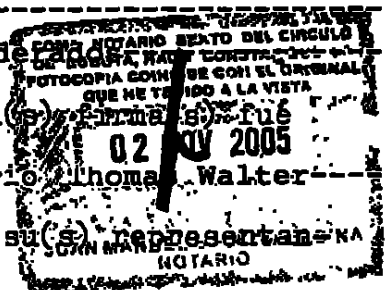
LUZ ARIAGA DE...
FOTOKOPIA 2 MIC. 1515...
Producción No. 555 Matrícula



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 Regional de Frankenthal (Pfalz)-----
que la compañía BASF 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 apoderado(s)-----
----- y cuya(s) firma(s) fue
(fueron) autenticada(s) ante el Notario Thomas Walter-----
----- es(son) su(s) representante(s)
te(s) legal(es) en este país.



El Cónsul General no asume responsabilidad por el contenido 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

Nº - 0077

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Don F. P. 64 por Law E. E. K. K.



Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

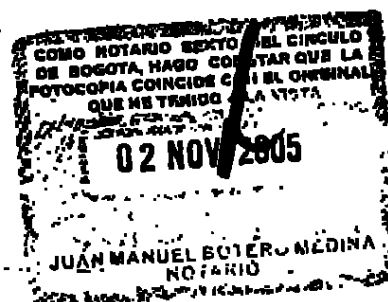
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá, 12 de ABR. 1988 No. 85064
HAGO CONSTAR
Que el Sr. Martha Niño
cuya firma aparece al fin del presente
documento, documentado en este fecha
de funciones en el cargo de
MIGUEL MARCOS ACUÑA
Secretario General

COMO NOTARIO SECTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
02 NOV 2005
JUAN MANUEL BOSERO MEDINA
NOTARIO

ESTADO GENERAL

2

11 NOV 2005



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.

[Handwritten signature and stamp area]



Handwritten text, possibly a signature or address, consisting of several lines of cursive script.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO COPIAR DE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
02 NOV 2001
JUAN MANUEL NOTERO MEDINA
NOTARIO

TRADUCCION 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.-

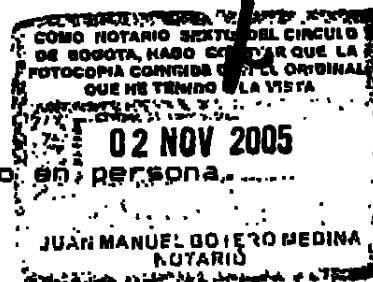
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

Protocolo notarial No. 1407/B9

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 Welzel y Richters los conozco en persona.



Certifico, por haber tenido a la vista el registro de comercio HR B 3000, del juzgado de Ludwigshafen, que los doctores Wlzel 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

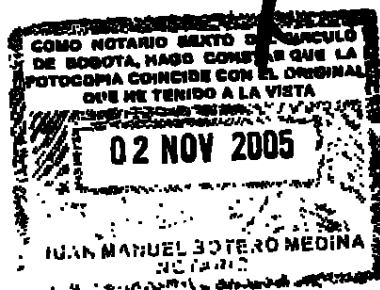
Notario de Ludwigshafen

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 HEISEN
TRADUCTORA INTERPRETE
Resolución No. 599 Ministros

El Presidente del Tribunal Regional

Fdn.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz 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, ocupando el No.
85061 del 24 de abril de 1989.

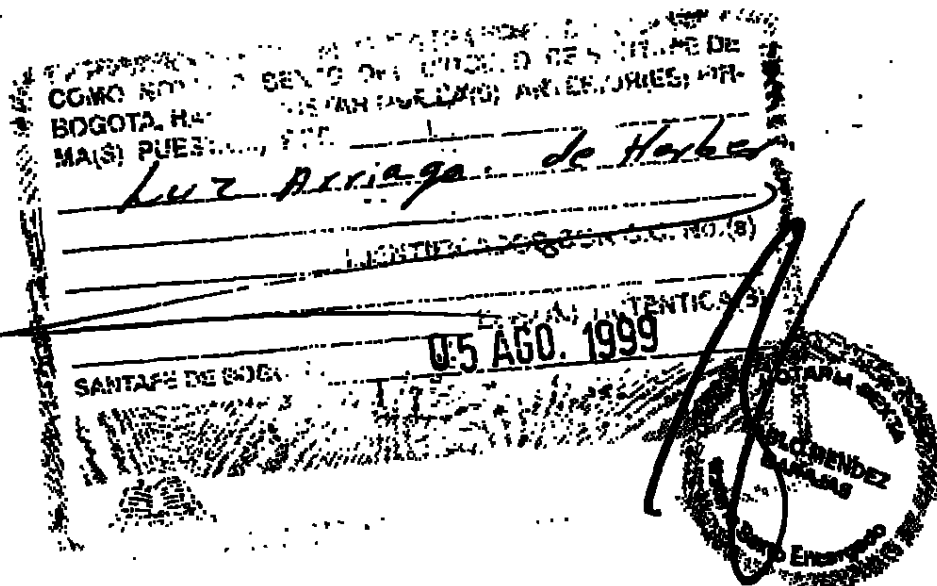
Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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 CIJUAL

Regulación No. 599 Ministerio



GRAN NOTARIO JUAN DE
DE NOTARIA, HAY EN EL MUNDO
OTRODA UNO CON UNO
QUE HE TENIDO A LA OTRA
DE NOTARIA
02 NOV 2005
JUAN DE NOTARIA
NOTARIO

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGATIZACIONES
Nº 88043
Hoy por 28 APR 1989
HACE CONSTAR
Que al señor
LUZ DE
cuya firma aparece al pie del presente
documento, desamparado en un hecho
de, ha sido el indicado.
División Consular
Embajada

RECEIVED
NOTARIA

881051599954

B C C 13
SUCURSALES



**DECLARACION Y PAGO DEL
IMPUESTO D
TIMBR
NACIONAL**

16 013 01 000045 1

RECIBO DE IMPUESTOS

16 013 01 000045 1

① Administración de impuestos de:		Código	② Teléfono
BOGOTA		0,3	2120100
③ Documento de identificación (marque X)		④ Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres).	
C.C. o T.I. ☐ C ☐ NIT. ☐ A ☒ Y No.	D.V. ☐ 3	CAVELIER ABOGADOS	
C.C. o T.I. ☐ C ☒ X NIT. ☐ A ☐ No.	D.V. ☐ 3	⑤ Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres).	
C.C. o T.I. ☐ C ☒ X NIT. ☐ A ☐ No.	D.V. ☐ 3	FORERO ROCHA JAIME	
⑦ Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4)		Municipio	Departamento
Cra. 4a. No. 72-35		BOGOTA	CUNDINAMARCA
⑧ Relación, título, tipo(s) de documento(s), indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción:		⑨ Número documento	
TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989		1	
PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER			
COLO 0361-52-218-8			

REVISADO
SECCION DE NEGOCIOS GERALES
SECCION DE ASUNTOS CONSULARES
SECCION DE RELACIONES EXTERIORES

COMO NOTARIO SEÑOR DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENDIDO A LA VISTA
02 NOV 2005
JUAN MANUEL ROCHA MEDINA
NOTARIO

Responsable del pago

Nombre

C.C. No. 19301629-35

1. VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	750
2. Retención	0
3. Impuesto a pagar	750
4. VALOR A PAGAR (suma de 2 + 3)	750
5. Valor a pagar en efectivo	750
6. Valor a pagar en cheque	0
7. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
8. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
9. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
10. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
11. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
12. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
13. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
14. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
15. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
16. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
17. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
18. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
19. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
20. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
21. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
22. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
23. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
24. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
25. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
26. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
27. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0
28. Valor a pagar en tarjeta de crédito	0
29. Valor a pagar en tarjeta de débito	0
30. Valor a pagar en tarjeta de prepago	0

1 037

750.00

CON PAGO

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

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

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLES: CAVELEYES

12

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, 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 Código de Procedimiento Civil ya que los otros faltan en este momento.

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER.

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

Acepto:

Emilio Ferrero

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 2282 de 1985)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá, comparecio, el Doctor SMILIO FERRAZ

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 429.91
expedida en VAQUIN y la tarjeta profesional
número 21.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: R.D. HUARAS (MEXICO)
y declaró que la firma que aparece en c. c. es: uya

FIRMA AUTOGRÁFA 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 2282 de 1985)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá, comparecio, el Doctor Gerardo

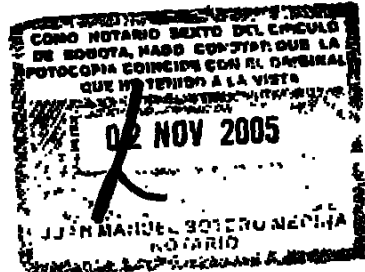
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 207224
expedida en 26 y la tarjeta profesional
número 637 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nuevos Creaneros
y declaró que la firma que aparece en él es: uya

FIRMA AUTOGRÁFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



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 Höhnhausen 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 ✓
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany
Frank Schieweck ✓
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

Anja Schwögl /
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany

Citizen of Germany

Maria Scherer /
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau
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: 7-ALQUENILAMINO-
Triazolo pirimidinas, procedimientos para su
obtención y el uso de las mismas para
controlar hongos nocivos, así como productos
que los contienen.
declaro(amos) así mismo que cedo(emos) y
transfiero(erimos), 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:

7-(Alkynylamino)triazolopyrimidines, their preparation
and their use in the control of harmful fungi, and
preparations comprising them

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.

CAVELIER ABOGADOS

WFFODERE-343

CO Assignment Form (11/198)

Dado y firmado hoy

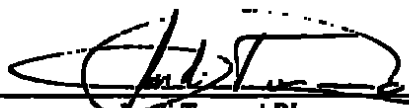
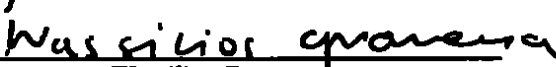
Given and signed this

18. März 2004.



Firma

Signature


Jordi Tormo i Blasco
Carsten Blettner
Bernd Müller
Markus Gewehr
Wassilios Grammerlos
Thomas Grote
Andreas Gypser
Joachim Rheinheimer
Peter Schäfer
Frank Schieweck

16

Anja Schwöglers

Anja Schwöglers

Maria Scherer

Maria Scherer

Siegfried Strathmann

Siegfried Strathmann

Ulrich Schöfl

Ulrich Schöfl

Reinhard Stierl

Reinhard Stierl

AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUO)

NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

A los días del mes de de 200

On this 18th day of March 2004

ante mí, Notario Público de

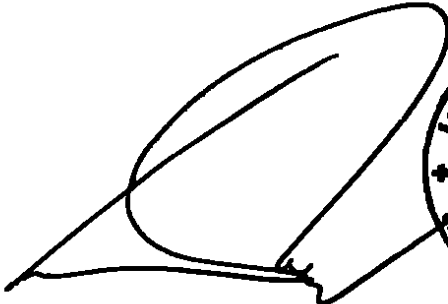
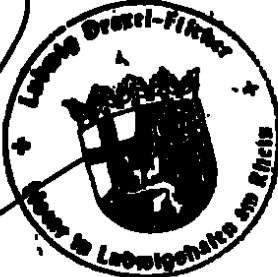
before me, a Notary Public ~~at~~ at Ludwigshafen,
Federal Republic of Germany

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 Schwögler, Maria
Scherer, Siegfried Strathmann, Ulrich
Schöfl and Reinhard Stierl

a 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~~se~~ (have)
legal capacity to execute it.

Notario Público

Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

CAVELIER ABOGADOS
WPPDERE-343

CAVELIER ABOGADOS

18

Urk.R.Nr. 513/2004

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 Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
4. Mr. Markus Gewehr, residing at Goethestr. 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 Höhnhausen 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 Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Germany, personally known to me,
10. Mr. Frank Schieweck, residing at Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Germany, personally known to me,
11. Mrs. Anja Schwöglor, residing at Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
12. Mrs. Maria Scherer, residing at Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Landau, Germany, personally known to me,

13. Mr. Siegfried Strathmann, residing at
Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Germany,
personally known to me,
14. Mr. Ulrich Schöfl, residing at Luftschifftring
22c, 68782 Brühl, Germany, personally known to
me,
15. Mr. Reinhard Stierl, residing at Jahnstr. 8,
67251 Freinsheim, Germany, personally known to
me,

are true and valid.

Ludwigshafen on Rhine, this 18th day of March, 2004



Notary Public

Wert: 5.112,92 Euro

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 23. März 2004
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 351-353/04

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



.....
(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

21

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 11.01/05a realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia, registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento 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; Wassilos Grammenos, Alexander-Fleming-Str.13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano griego; Thomas Grote, Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, ciudadano alemán; Andreas Gypser, 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; Maria Scherer, Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau, Alemania, ciudadano alemán; Siegfried Strathmann, Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, ciudadano alemán, Ulrich Schöfl, Luftschifftring 22c, 68782 Brühl, Alemania, ciudadano alemán; Reinhard Stierl, Jahnstr.8, 67251 Freinsheim, Alemania, ciudadano alemán; declaran bajo juramento ser únicos y verdaderos inventores de la invención: "7-alquenilamino-triazolopirimidinas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para controlar hongos nocivos, así como productos que lo contienen" y declaran así mismo que ceden y transfieren sin limitación a favor de la sociedad BASF Aktiengesellschaft constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania domiciliada en el 67056 Ludwigshafen, Alemania todos los derechos inherentes a dicha

22

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

Dado y firmado el 18 de marzo de 2004.

Firmas ilegibles de todos los inventores mencionados anteriormente.

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (INDIVIDUO) del 18 de marzo de 2004 por medio de la cual se autentican las firmas de Jordi Tormo i Blasco, Carsten Blettner, Bernd Müller, Markus Gewehr, Wassilos Grammenos, Thomas Grote, Andreas Gypser, Joachim Rheinheimer, Peter Schäfer, Frank Schieweck, Anja Schwöglér, Maria Scherer, Siegfried Strathmann, Ulrich Schöfl y Reinhard Stierl en el anterior documento así como su capacidad legal otorgarlo.

Firma Ilegible

Sello Notarial

Urk.R. Nr. 513/2004

Yo, Ludwig Draxel-Fischer, Notario Público de Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente testifico y confirmo que las firmas anteriores de

1. El señor Jordi Tormo i Blasco, domiciliado en Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania, a quién conozco personalmente,
2. El señor Carsten Blettner, domiciliado en Richard-Wagner-Str.48, 68165, Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
3. El señor Bernd Müller, domiciliado en Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal, Alemania, a quién conozco personalmente,
4. El señor Markus Gewehr, domiciliado en Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Alemania, a quién conozco personalmente,
5. El señor Wassilos Grammenos, domiciliado en Alexander-Fleming-Str.13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, a quién conozco personalmente,
6. El señor Thomas Grote, domiciliado en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

7. El señor Andreas Gypser, domiciliado en B 4, 4, 68159 Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
 8. El señor Joachim Rheinheimer, domiciliado en Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, a quién conozco personalmente,
 9. El señor Peter Schäfer, domiciliado en Römerstr.1, 67308 Ottersheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
 10. El señor Frank Schieweck, domiciliado en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
 11. La señora Anja Schwöglar, domiciliada en Heinrich-Lanz-Str.3, 68165 Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
 12. La señora Maria Scherer, domiciliada en Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau, Alemania, a quién conozco personalmente,
 13. El señor Siegfried Strathmann, domiciliado en Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, a quién conozco personalmente,
 14. El señor Ulrich Schöfl, domiciliado en Luftschifftring 22c, 68782 Brühl, Alemania, a quién conozco personalmente,
 15. El señor Reinhard Stierl, domiciliado en Jahnstr.8, 67251 Freinsheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
- son auténticas y válidas.

Ludwigshafen/Rhine, hoy 18 de Marzo de 2004

Sello de
Oblea

Firma Ilegible
Notario Público

(Anexo)

Sello de Apostille expedido en la República Federal de Alemania y certificada el 23 de Marzo de 2004 con el Nr. 91 Eb - 351-353/04 ✓ firmado por Christian Köneke

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

DVZ//ID-007227/WPCL002G/COLO 00361-841-061-1

DIEGO F. VARGAS Z.
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLÉS - INGLÉS - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

175977
Diego Vargas
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 NOV -2 P 1:44

UCB

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

TRADUCCION OFICIAL No. 11907

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
domiciliado en Carl-Benz-Str: 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania
Ciudadano de España
- Carsten Blettner
domiciliado en Richard- Wagner-Str: 48, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Bernd Müller
domiciliado en Stockingerstr.7, 67227 Frartkenthal, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Markus Gewehr
domiciliado en Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Wassilios Grammenos
domiciliado en Alexander-Fleming-Str: 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania
Ciudadano de Grecia
- Thomas Grote
domiciliado en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachertheint, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Andreas Gypser
domiciliado en B 4 4, 68159 Mannheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Joachim Rheinheimer
domiciliado en Merziger Str:24, 67063 Ludwigshafen, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Peter Schäfer
domiciliado en Römerstr.1, 67308 Ottersheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Frank Schieweck
domiciliado en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Anja Schwögler
domicillada en Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadana de Alemania

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA Y INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

- Maria Scherer
domiciliada en Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau, Alemania
Ciudadana de Alemania
- Siegfried Strathmann,
domiciliado en Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof, Alemania,
Ciudadano de Alemania,
- Ulrich Schöff
domiciliado en Luftschifftring 22c, 68782 Brühl, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Reinhard Stierl
domiciliado en Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

declaran bajo juramento ser los únicos y verdaderos inventores de la invención

7-alquenilamino-triazolopirimidinas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para controlar hongos nocivos así como productos que las contienen

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, 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. Hay quince firmas ilegibles. Dado y firmado el 18 de marzo 2004.

Autenticación notarial en inglés de las quince firmas antecedentes (individuo) por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 18 de marzo 2004. Fdo.: firma ilegible, sello notarial en tinta.

Autenticación notarial en inglés de las firmas quince antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 18 de marzo 2004, bajo el No. 513/2004. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros

LUE ANHARA DE HERBER
TRADUCTORA Y INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.598 Minjusticia

76

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 Draxel-Fischer

3. Actuando en calidad de notario público

**4. Lleva el sello oficial del notario Draxel-Fischer,
notario de Ludwigshafen am Rhein**

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)

6. el 23 de marzo 2004

7. por el Presidente del Tribunal Regional

8. bajo el No. 91 Eb - 351-353/04 ✓

9. Sello

(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma

Fdo.: firma ilegible

(Christian Köneke)

Juez del Tribunal Regional

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, 31 de octubre 2005

c. 3029

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución 1400 de 1998
Ministerio de Justicia

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

175978
COTA FIEN
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 NOV -2 P 1:44

JCS
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



54420 030311

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
14. Oktober 2004 (14.10.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/087706 A1

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 487/04.
A01N 43/90

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/003346

(22) Internationales Anmeldedatum:
30. März 2004 (30.03.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 14 930.9 2. April 2003 (02.04.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder: und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO,
Jordi [ES/DE]: Karl-Benz-Strasse 10-3, 69514 Lau-
denbach (DE). BLETINER, Carsten [DE/DE]:
Richard-Wagner-Strasse 48, 68165 Mannheim (DE).
MÜLLER, Bernd [DE/DE]: Stockingersstrasse 7, 67227
Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]:
Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAM-
MIENOS, Wasmikus [GR/DE]: Alexander-Fleming-Strasse
13, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas
[DE/DE]: Im Hühnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE).

GYPSEK, Andreas [DE/DE]: B 4.4, 68159 Mannheim
(DE). RHEINHEIMER, Jochim [DE/DE]: Metzger
Strasse 24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER,
Peter [DE/DE]: Römerstrasse 1, 67308 Otterheim (DE).
SCHIEWECK, Frank [DE/DE]: Lindenweg 4, 67258
Heißenheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]: Hein-
rich-Lanz-Strasse 3, 68165 Mannheim (DE). SCHERER,
Maria [DE/DE]: Hermann-Jürgens-Strasse 30, 76829
Landau (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]: Don-
nersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL,
Ulrich [DE/DE]: Erlensr. 8, 68782 Brühl (DE). STIEHL,
Reinhard [DE/DE]: Jahnstrasse 8, 67251 Freinsheim
(DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGE-
SELLSCHAFT: 67056 Ludwigshafen (DE).

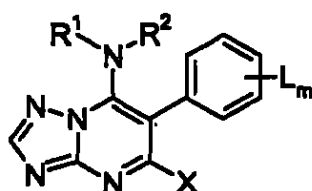
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, 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 (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 7-ALKINYLAMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINES. METHODS FOR THE PRODUCTION AND USE THEREOF TO COMBAT HARMFUL FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: 7-ALKINYLAMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(I)

(57) Abstract: 7-alkinylamino-triazolopyrimidines of formula (I), wherein the sub-
stituents have the following meanings: L = halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy,
amino, NHR, NR, cyano, Si(O)_nA¹ or C(O)A²; R = alkyl or alkylcarbonyl; A¹ =
hydrogen, hydroxy, alkyl, alkylamino or dialkylamino; n = 0, 1 or 2; A² = alkenyl,
alkoxy, halogenalkoxy or one of the groups cited in A¹; m = 1, 2, 3, 4 or 5, whereby
at least one group L is present in an ortho-position to the bond with the triazolopy-
rimidine skeleton; X = halogen, cyano, alkyl, halogenalkyl or alkoxy; R¹ = hydro-
gen or alkyl; R² = alkyl which can be unsubstituted or substituted according to

the description. The invention also relates to methods for the production of said compounds, agents containing said compounds and
the use thereof to combat harmful phytopathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: 7-Alkinylamino-Triazolopyrimidine der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: L
Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Amino, NHR, NR, Cyano, Si(O)_nA¹ oder C(O)A², R Alkyl oder Alkylcarbonyl; A¹ Wasser-
stoff, Hydroxy, Alkyl, Alkylamino oder Dialkylamino n 0, 1 oder 2; A² Alkenyl, Alkoxy, Halogenalkoxy oder eine der bei A¹ genann-
ten Gruppen; m 1, 2, 3, 4 oder 5, wobei mindestens eine Gruppe L in ortho-Stellung zu der Bindung mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst
vorliegt; X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl oder Alkoxy; R¹ Wasserstoff oder Alkyl; R² Alkyl, welches unsubstituiert oder
gemäß der Beschreibung substituiert sein kann; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre
Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

161

WO 2004/087706 A1

GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), caraisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europaisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchebericht

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

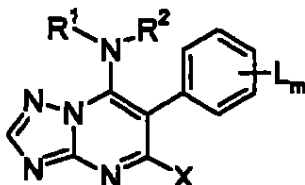
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

7-Alkinylamino-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 7-alkinylamino-Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 10 L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(O)_nA¹ oder C(O)A²,
- R C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkylcarbonyl;
- 15 A¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylamino oder Di-(C₁-C₆-alkyl)amino
- n 0, 1 oder 2;
- 20 A² C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder eine der bei A¹ genannten Gruppen;
- m 1, 2, 3, 4 oder 5, wobei mindestens eine Gruppe L in ortho-Stellung zu der Bindung mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst vorliegt;
- 25 X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- R¹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- 30 R² C₃-C₁₀-Alkynyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R³ tragen kann:
- R³ Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder C₃-C₆-Cycloalkyl,
- 35

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

5 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, 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.

15 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

20 Aus EP-A 71 792 und EP-A 550 113 sind 6-Phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. Die in den genannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

25 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

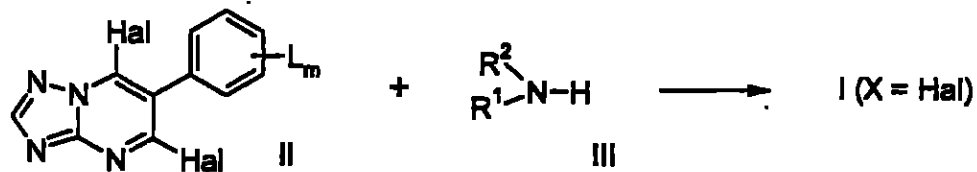
30 Demgemäss wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

35 Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch die Ausgestaltung der Substitution der 6-Phenylgruppe, die zwingend in ortho-Stellung substituiert ist.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

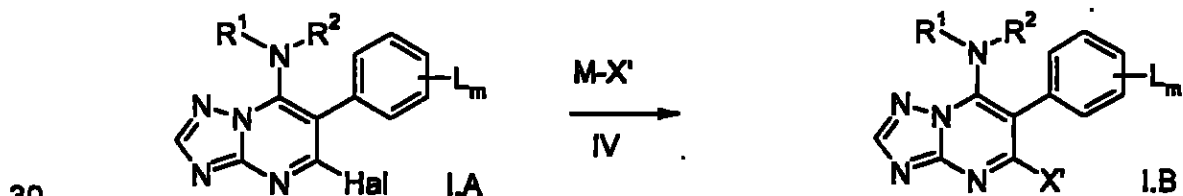
40 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von Dihalogentriazolopyrimidinen der

Formel II, in der Hal für ein Halogenatom, wie Brom oder, insbesondere Chlor, mit Aminen der Formel III unter allgemein aus WO 98/46608 bekannten Bedingungen erhalten.



- 5 Die Umsetzung von II mit Aminen III wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol.
- 10 Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganischen Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel III kann als Base dienen.
- 15 Amine der Formel III sind z.T. bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden, beispielsweise aus den entsprechenden Alkoholen über die Tosylate und Phthalimide [vgl. J. Am. Chem. Soc., Bd. 117, S. 7025 (1995); WO 93/20804], durch Reduktion der entsprechenden Nitrile [vgl. Heterocycles, Bd. 35, S. 2 (1993); Synthetic Commun. Bd. 25, S. 413 (1995); Tetrahedron Lett., S. 2933 (1995)], oder reduktive
- 20 Aminierung von Ketonen [vgl. J. Am. Chem. Soc., Bd. 122, S. 9556 (2000); Org. Lett. S. 731 (2001); J. Med. Chem., S. 1566 (1988)], aus den entsprechenden Halogeniden [vgl. Synthesis, S. 150 (1995)] und ggf. anschließender Alkylierung. Der Aufbau der Gruppe R² kann gegebenenfalls durch Grignard-Reaktion an entsprechenden Nitrilen oder Carbonsäureanhydriden erfolgen [vgl. J. Org. Chem., S. 5056 (1992); Tetra-
- 25 hedron Lett., S. 2933 (1995)].

Verbindungen der Formel I, in der X Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy bedeutet (Formel I.B), können vorteilhaft aus Verbindungen I, in der X Halogen [Hal], bevorzugt Chlor bedeutet, hergestellt werden, welche Formel I.A entsprechen.



30

Verbindungen I.A werden mit Verbindungen M-X' (Formel IV) zu Verbindungen I.B umgesetzt. Verbindungen IV stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in

Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel IV hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.

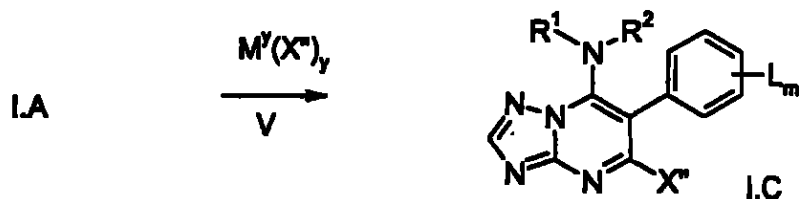
- 5 Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

- Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische
10 Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

Verbindungen I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl steht (Formel I.C), können vorteilhaft ausgehend von Ausgangsstoffen der Formel I.A auf den nachfolgend skizzierten Routen hergestellt werden.

15

Verbindungen der Formel I.C, in denen Xⁿ C₁-C₄-Alkyl bedeutet, können durch Kupplung von 5-Halogen-1,2,4-triazolopyrimidinen der Formel I.A, mit metallorganischen Reagenzien der Formel V erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



20

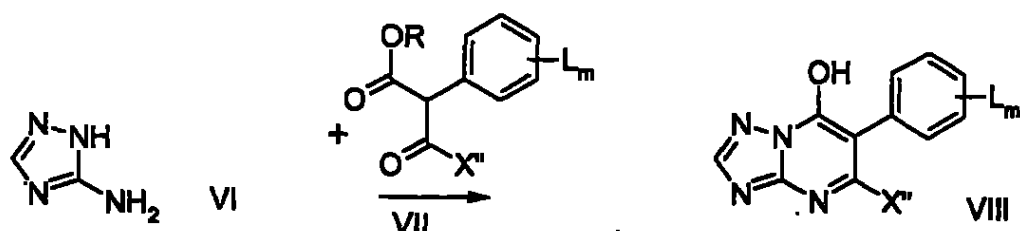
- In Formel V steht Xⁿ für C₁-C₄-Alkyl und M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, S.733 (1990); J. Org. Chem., Bd.
25 43, S.358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. S.866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, S.8267 (1993); ebenda, Bd. 33, S.413 (1992).

- Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht (Formel I.C), können vorteilhaft auch durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

30

- Ausgehend von 5-Aminotriazol VI und dem Ketoester VII werden 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII erhalten. In Formel VII steht R für eine C₁-C₄-Alkylgruppe, insbesondere für Methyl oder Ethyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern VIIa mit Xⁿ=CH₃ werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyl
35 triazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. 5-Aminotriazol VI ist kommerziell erhältlich. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen VII erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 bekannten Bedingungen.

5



Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel IX umgesetzt.



- 5 Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C.



10

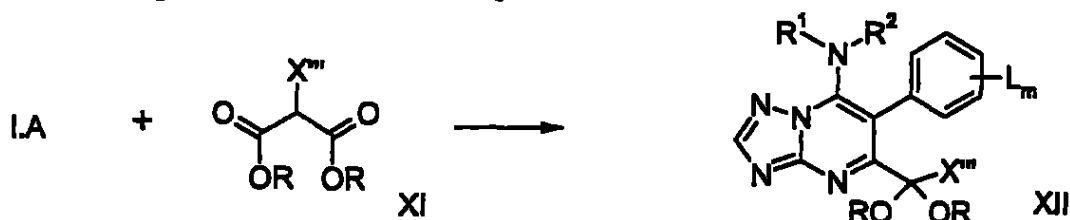
Die Umsetzung von IX mit Aminen III wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO 98/46608].

15

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganischen Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel III kann als Base dienen.

20

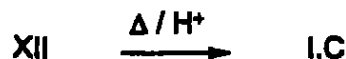
Verbindungen der Formel I.C, können alternativ auch aus Verbindungen I.A und Malonaten der Formel XI hergestellt werden. In Formel XI bedeuten X''' Wasserstoff, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -Alkyl oder $\text{C}_1\text{-C}_3$ -Halogenalkyl und R $\text{C}_1\text{-C}_2$ -Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel XII umgesetzt und zu Verbindungen I.C decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].



25

Die Malonate XI sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- 5 Die anschließende Verseifung des Esters XII erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen XII vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I.C bereits ganz oder teilweise erfolgen.



- 10 Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

- Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

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

- 35 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

- 40 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure-

oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

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

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

10

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₈-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 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-Dimethylbutyl, 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;

15

- 20 Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2 oder 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, 25 Dichlorfluormethyl oder Chlordifluormethyl;

- Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₈-Alkynyl wie Ethinyl, 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, 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, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

30

35

- 40 Sofern R² ein Chiralitätszentrum aufweist, sind die (R)- und (S)-Isomere und die Racemate 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 L_m , R^1 , R^2 und X der Formel I.

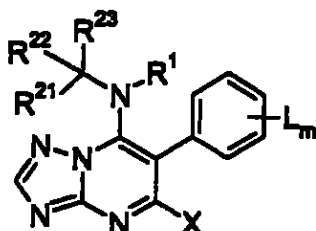
- 5 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 Wasserstoff bedeutet.

10

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^1 für Methyl oder Ethyl steht.

Verbindungen der Formel I, in der die Gruppe R^2 in α -Stellung eine Verzweigung aufweist (Formel I.1), sind ein bevorzugter Gegenstand der Erfindung:



I.1

15

Dabei bedeuten R^{21} Methyl oder Halogenmethyl, R^{22} Wasserstoff, Methyl oder Halogenmethyl und R^{23} C_2-C_8 -Alkynyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann. Die übrigen Variablen sind wie in Formel I definiert.

20

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen I.1, in denen R^{23} für geradkettiges oder verzweigtes C_2-C_8 -Alkynyl steht, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei C_1-C_3 -Alkoxygruppen tragen kann. Ein besonders bevorzugter Gegenstand sind Verbindungen I, in denen R^{23} für geradkettiges oder verzweigtes C_2-C_8 -Alkynyl steht, welches unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert ist.

25

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen der Formel I, in der R^2 für eine der folgenden Gruppen steht: $CH_2C \equiv CH$, $CH_2C \equiv CCH_3$,

30

$CH_2C \equiv CCH_2Cl$, $CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH_2CH_2C \equiv CH$, $CH_2CH_2C \equiv CCH_3$,

$CH_2CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2C \equiv CH$, $CH_2CH_2CH_2C \equiv CCH_3$,

$CH_2CH_2CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CH_3)C \equiv CH$, $CH(CH_3)C \equiv CCH_3$,

$CH(CH_3)C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CH_3)C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CH_3)CH_2C \equiv CH$,

$CH(CH_3)CH_2C \equiv CCH_3$, $CH(CH_3)CH_2C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CH_3)CH_2C \equiv CCH_2CH_3$,

35

$C(CH_3)_2C \equiv CH$, $C(CH_3)_2C \equiv CCH_3$, $C(CH_3)_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CF_3)C \equiv CH$,

$CH(CF_3)C \equiv CCH_3$, $CH(CF_3)C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CF_3)C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CF_3)CH_2C \equiv CH$,

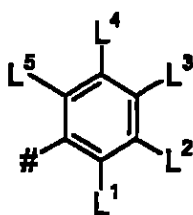
$\text{CH}(\text{CF}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$, $\text{CH}(\text{CF}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{Cl}$, $\text{CH}(\text{CF}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$, welche Gruppen unsubstituiert oder durch eine bis drei Gruppen R^a substituiert sein können.

Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen, insbesondere Chlor, steht (Formel I.A), sind ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung.

Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen der Index m den Wert 1, 2 oder 3 aufweist.

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen L_m Fluor, Chlor, Methyl, C_1 -Halogenalkyl, Methoxy, Amino, NHR oder NR_2 , worin R Methyl oder Acetyl ist, bedeutet.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen die durch L_m substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A



A

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ;

L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;

L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH_3 , OCH_3 , Amino, NHR oder NR_2 ; und

L^5 Wasserstoff, Chlor, Fluor oder CH_3 bedeuten.

25

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen L_m für eine der folgenden Substituentenkombinationen steht: 2-Fluor-6-chlor, 2,6-Difluor, 2,6-Dichlor, 2-Fluor-6-methyl, 2,4,6-Trifluor, 2,6-Difluor-4-methoxy, Pentafluor, 2-Methyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl; 2-Methoxy-6-fluor, 2-Chlor, 2-Fluor, 2,4-Difluor, 2-Fluor-4-chlor, 2-Chlor-4-fluor, 2,3-Di-
fluor, 2,5-Difluor, 2,3,4-Trifluor, 2-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Methyl-4-chlor, 2-Fluor-4-
methyl, 2,6-Dimethyl, 2,4,6-Trimethyl, 2,6-Difluor-4-methyl, 2-Trifluormethyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl-5-fluor oder 2-Trifluormethyl-5-chlor.

30

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen X Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl, wie Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

35

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden 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.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-chlor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dichlor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-methyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trifluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methoxy bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m Pentafluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl-4-fluor bedeuten und die

Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 9

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 10

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methoxy-6-fluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 11

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Chlor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 12

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4-Difluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-4-chlor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Chlor-4-fluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 16

- Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,3-Difluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,5-Difluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 18

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,3,4-Trifluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 19

10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 20

15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4-Dimethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 21

20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl-4-chlor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 22

25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dimethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 24

35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trimethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 29

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-5-cyano bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 30

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle A

Nr.	R^1	R^2
A-1	H	$CH_2C \equiv CH$
A-2	CH_3	$CH_2C \equiv CH$
A-3	CH_2CH_3	$CH_2C \equiv CH$
A-4	H	$CH_2C \equiv CCH_3$
A-5	CH_3	$CH_2C \equiv CCH_3$
A-6	CH_2CH_3	$CH_2C \equiv CCH_3$
A-7	H	$CH_2C \equiv CCH_2Cl$
A-8	CH_3	$CH_2C \equiv CCH_2Cl$
A-9	CH_2CH_3	$CH_2C \equiv CCH_2Cl$
A-10	H	$CH_2C \equiv CCH_2CH_3$

Nr.	R ¹	R ²
A-11	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-12	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-13	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-14	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-15	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-16	H	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-17	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-18	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-19	H	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-20	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-21	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-22	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-23	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-24	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-25	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-26	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-27	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-28	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-29	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-30	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-31	H	CH(CH ₃)C≡CH
A-32	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
A-33	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
A-34	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₃
A-35	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₃
A-36	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₃
A-37	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-38	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-39	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-40	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-41	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-42	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-43	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-44	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-45	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-46	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-47	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-48	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-49	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-50	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-51	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-52	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-53	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-54	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-55	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH
A-56	CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CH
A-57	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CH
A-58	H	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₃
A-59	CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₃
A-60	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₃
A-61	H	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-62	CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-64	H	CH(CF ₃)C≡CH
A-65	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CH
A-66	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CH
A-67	H	CH(CF ₃)C≡CCH ₃
A-68	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₃
A-69	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₃
A-70	H	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ Cl

Nr.	R ¹	R ²
A-71	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-72	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-73	H	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-74	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-75	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-76	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CH
A-77	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CH
A-78	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CH
A-79	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-80	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-81	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-82	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-83	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-84	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-85	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-86	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-87	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. 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,
- 5 • *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,
- 10 • *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,
- 15 • *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Bimen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-*
clomyces variotii im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
 20 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
 25 nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

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

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

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

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

40

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 Dispergiernmitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, 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 Dispergiernmittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, 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. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

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 Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver 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.

Beispiele für Formulierungen sind:

20

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

25

II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

30

III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

35

IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und

5Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

5 V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).

10 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).

15 VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Vertellen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

20

VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch
25 feines Vertellen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern,
30 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.

35

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
40 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.

- 5 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%.

- 10 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.

- 15 Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, 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.

- 20 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.

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

- 30
- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
 - Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
 - Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
 - Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
 - 35 • Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
 - Dicarboximide wie Iprodion, Myclobutin, Procymidon, Vinclozolin,

- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyklische 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, Siltthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenyl-derivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl,
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel,
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Bentiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Tolclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid,
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäure-derivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid,
- Zimtsäureamide und Analoga wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele

25

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 den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

30

Beispiel 1: Herstellung von 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-propargylamino[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-1]

35

Eine Lösung von 1,5 mmol 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [vgl. WO 98/46607] in 20 ml Dichlormethan wurde unter Rühren mit einer Lösung von 1,5 mmol Propargylamin und 1,5 mmol Triethylamin in 10 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 – 25°C gerührt, dann mit verd. HCl-Lösung gewaschen. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 0,42 g der Titelverbindung vom Fp. 141 °C.

40

Beispiel 2: Herstellung von 5-Cyano-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(N-methyl-N-propargyl-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

- 5 Eine Mischung von 0,1 mol der Verbindung 1-2 und 0,25 mol Tetraethylammonium cyanid in 750 ml Dimethylformamid (DMF) wurde etwa 16 Std. bei 20-25°C gerührt. Nach Zusatz von Wasser und Methyl-tert.butylether (MTBE) und Phasentrennung wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen, dann getrocknet und von Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 4,72 g der
10 Titelverbindung vom Fp. 147 °C.

Beispiel 3: Herstellung von 5-Methoxy-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(N-methyl-N-propargylamino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

- 15 Eine Lösung von 65 mmol der Verbindung 1-2 in 400 ml wasserfr. Methanol wurde mit 71,5 mmol Natriummethanolat-Lösung (30%ig) bei 20-25°C versetzt. Nach etwa 16 Std. Rühren bei dieser Temperatur wurde das Lösungsmittel abdestilliert, der Rückstand wurde mit Dichlormethan aufgenommen. Die organische Phase wurde nach Waschen mit Wasser getrocknet, dann von Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand
20 erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 3,94 g der Titelverbindung vom Fp. 119 °C.

Beispiel 4: Herstellung von 5-Methyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(N-methyl-N-propargyl-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

- 25 Eine Mischung von 20 ml Diethylmalonat und 0,27 g (5,65 mmol) Natriumhydrid (50% Dispersion in Mineralöl) in 50 ml Acetonitril wurde bei 20-25°C etwa 2 Std. gerührt. 4,7 mmol der Verbindung 1-2 wurden zugesetzt, dann wurde die Mischung bei 60°C etwa 20 Std. gerührt. Nach Zusatz von 50 ml wässr. Ammoniumchlorid-Lösung wurde
30 mit verd. HCl-Lösung angesäuert, dann die Mischung mit MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden nach Trocknung vom Lösungsmittel befreit. Das durch Chromatographie an Kieselgel gereinigte Rohprodukt wurde mit konz. HCl. aufgenommen, die Mischung dann etwa 24 Std. bei 80°C gerührt. Nach Abkühlen wurde mit wässr. NaOH-Lösung ein pH-Wert von 5 eingestellt und die Reaktionsmischung mit
35 MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden nach Trocknung vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 0,62 g der Titelverbindung.

¹H-NMR (δ in ppm): 8,40 (s); 8,85 (m); 4,30 (d); 2,85 (s); 2,45 (s); 2,27 (s).

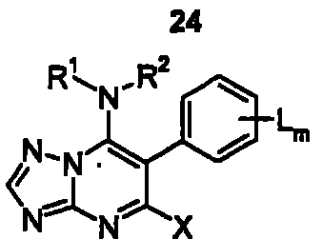


Tabelle I

Nr.	R ¹	R ²	X	L _m	phys. Daten (Fp. [°C])
I-1	H	CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	141
I-2	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	143
I-3	H	CH ₂ C≡CCH ₂ Cl	Cl	2,4,6-F ₃	173
I-4	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	227
I-5	H	CH ₂ C≡CH	Cl	2-Cl-6-F	190
I-6	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH	Cl	2-Cl-6-F	198
I-7	H	CH ₂ C≡CCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	210
I-8	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	153
I-9	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	66
I-10	H	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	149
I-11	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	89
I-12	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	151
I-13	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	140
I-14	H	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	155
I-15	H	(CH ₂) ₃ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	152
I-16	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2-CH ₃ -4-F	97
I-17	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2,4-F ₂	106
I-18	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2-Cl-4-F	108

Aufgrund der gehinderten Rotation der Phenylgruppe können zwei Diastereomeren existieren, die sich in ihren physikalischen Eigenschaften unterscheiden können.

5

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

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

10

Die Wirkstoffe wurden getrennt als eine Stammlösung aufbereitet mit 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 und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

15

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani*

5 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporen-
aufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^8$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-
10 gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich der Blattbefall auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

15 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. I-3 und I-4 behandelten Pflanzen bis zu 3% Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.

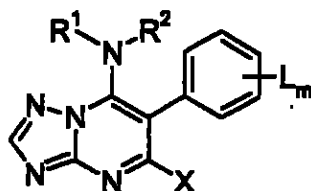
Anwendungsbeispiel 2 - Kurative Wirksamkeit gegen Weizenbraunrost verursacht durch *Puccinia recondita*

20 Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizensämlingen der Sorte "Kanzler" wurden mit Sporen des Braunrostes (*Puccinia recondita*) bestäubt. Danach wurden die Töpfe für 24 Stunden in eine Kammer mit hoher Luftfeuchtigkeit (90 bis 95 %) und 20 bis 22°C gestellt. Während dieser Zeit keimten die Sporen aus und die Keimschläuche drangen in das Blattgewebe ein. Die infizierten Pflanzen wurden am nächsten Tag mit einer wässrigen
25 Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Die Suspension oder Emulsion wurde aus einer Stammlösung angesetzt mit 10 % Wirkstoff in einer Mischung bestehend aus 89 % Aceton, und 1 % Emulgiermittel. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C und 65 bis 70 % relativer Luftfeuchte für 7 Tage
30 kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Rostpilzentwicklung auf den Blättern ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. I-3 und I-4 behandelten Pflanzen weniger als 3% Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.

Patentansprüche

1. 7-Alknylamino-Triazolopyrimidine der Formel I

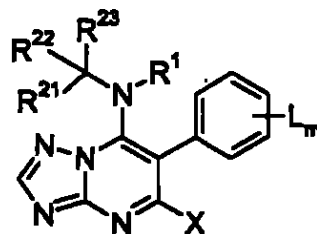


5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(O)_nA¹ oder C(O)A²,
- 10 R C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkylcarbonyl;
- A¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylamino oder Di-(C₁-C₆-alkyl)amino
- 15 n 0, 1 oder 2;
- A² C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder eine der bei A¹ genannten Gruppen;
- 20 m 1, 2, 3, 4 oder 5, wobei mindestens eine Gruppe L in ortho-Stellung zu der Bindung mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst vorliegt;
- X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- 25 R¹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- R² C₃-C₁₀-Alkynyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann:
- 30 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder C₃-C₆-Cycloalkyl,
- 35 wobei diese aliphatischen oder alicyclischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

- 5 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy carbonyl, 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.
- 10

2. Verbindungen der Formel I.1



I.1

15 in der

R^{21} Methyl oder Halogenmethyl;

R^{22} Wasserstoff, Methyl oder Halogenmethyl

20

R^{23} C_2-C_8 -Alkynyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann;

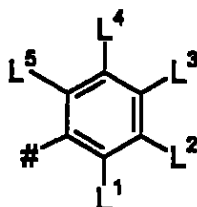
und die anderen Variablen gemäß Anspruch 1 definiert sind.

25

3. Verbindungen der Formel I oder I.1 gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

4. Verbindungen der Formel I oder I.1 gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A

30



A

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ;

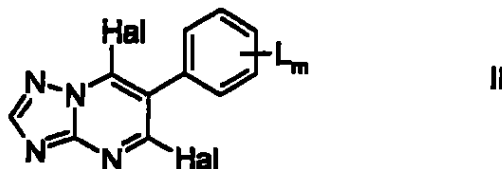
L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;

L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH_3 , OCH_3 , Amino, NHR oder NR_2 ; und

L^5 Wasserstoff, Fluor oder CH_3 bedeuten.

5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für eine der folgenden Substituentenkombinationen steht: 2-Fluor-6-chlor, 2,6-Difluor, 2,6-Dichlor, 2-Fluor-6-methyl, 2,4,6-Trifluor, 2,6-Difluor-4-methoxy, Pentafluor, 2-Methyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl, 2-Methoxy-6-fluor, 2-Chlor, 2-Fluor, 2,4-Difluor, 2-Fluor-4-chlor, 2-Chlor-4-fluor, 2,3-Difluor, 2,5-Difluor, 2,3,4-Trifluor, 2-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Methyl-4-chlor, 2-Fluor-4-methyl, 2,6-Dimethyl, 2,4,6-Trimethyl, 2,6-Difluor-4-methyl, 2-Trifluormethyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl-5-fluor oder 2-Trifluormethyl-5-chlor.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 5 durch Umsetzung von Dihalogentriazolopyrimidinen der Formel II,



in der die Variablen die für Formel I gegebene Bedeutung haben und Hal für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor steht, mit Aminen der Formel III



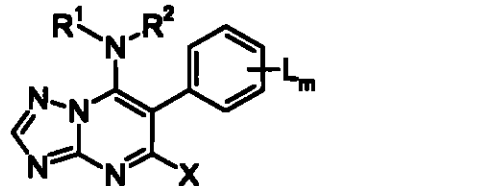
7. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.
8. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

7-Alquinilamino-triazolopirimidinas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para controlar hongos nocivos, así como productos que los contienen

Descripción

5

La presente invención se refiere a 7-alquinilamino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10 L significan, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, amino, NHR, NR₂, ciano, S(O)_nA¹ o C(O)A²,

R es alquilo C₁-C₈ o alquilcarbonilo C₁-C₈;

15 A¹ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₈, alquilamino C₁-C₈ o di-(alquil-C₁-C₈)-amino

n es 0, 1 ó 2;

20 A² es alqueno C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, halógenoalcoxi C₁-C₈ o uno de los grupos mencionados para A¹;

m es 1, 2, 3, 4 ó 5, estando por lo menos un grupo L en posición orto frente al enlace con el esqueleto de triazolopirimidina;

25

X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halógenoalquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

R¹ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄;

R² es alquilo C₃-C₁₀, que puede ser no sustituido o estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^a:

5 **R^a** es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, alquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆,
alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, di -alquilamino-C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₃-C₆ o -cicloalquilo C₃-C₆.

10 cuyos grupos alifáticos o alicíclicos pueden a su vez estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^b :

R^b es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquilíto, alquil-amino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquil-sulfoxilo, alcóxicarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, cuyos grupos alquilo en estos radicales pueden con- tener 1 a 6 átomos de carbono y cuyos grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales pueden contener 2 a 8 átomos de carbono.

25 Además, la invención se refiere a procedimientos para la obtención de estos compuestos, a productos que los contienen, así como el uso de los mismos para controlar hongos fitopatógenos.

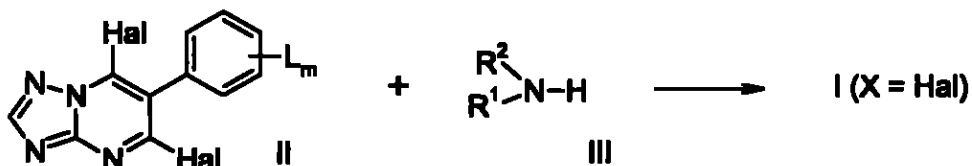
De la EP-A 71 792 y la EP-A 550 113 se conocen, generalmente, las 6-fenil-7-amino-triazolopirimidinas. Los compuestos descritos en las memorias mencionadas se usan para controlar hongos nocivos.

Pero su efecto no es satisfactorio en muchos casos. Partiendo de ello, la presente invención tiene po objeto proveer compuestos con efecto mejorado y/o espectro de acción más amplio

- 5 Por tanto, se encontraron los compuestos definidos al comienzo. Además, se encontraron procedimientos y productos intermedios para su obtención, productos que los contienen, así como procedimientos para controlar hongos nocivos usando estos compuestos I.
- 10 Los compuestos de la fórmula I se diferencian de los compuestos indicados en las memorias arriba citadas en la forma de sustitución del grupo 6-fenilo, que forzosa-mente está sustituido en la posición orto .

Los compuestos de la fórmula I presentan una más alta eficiencia contra hongos
15 nocivos, en comparación con los compuestos conocidos.

Los compuestos de la invención pueden ser preparados, valiéndose de diferentes métodos . Ventajosamente, se preparan, haciendo reaccionar dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula II, en la que Hal representa un átomo de
20 halógeno, como p.ej. bromo o, especialmente, cloro, con aminas de la fórmula III bajo las condiciones generalmente conocidas de la memoria WO 98/46608.



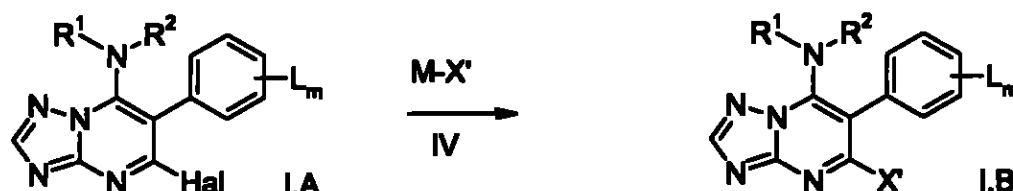
La reacción de II con aminas III se efectúa, ventajosamente, a 0°C hasta 70°C, pre-ferentemente, 10°C hasta 35°C, preferentemente, en presencia de un disolvente
25 inerte, como p.ej. un éter, tal como dioxano, éter dietílico o, especialmente, tetra-hidrofurano, hidrocarburos halogenados, como p.ej. diclorometano e hidrocarburos aromáticos, como p.ej. tolueno.

✓

Es preferible usar una base, p.ej. una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o una base inorgánica, como p.ej. carbonato de potasio; también se puede usar amina excesiva de la fórmula III como base.

- 5 Aminas de la fórmula III son, en parte, conocidas o pueden ser preparadas mediante métodos conocidos, por ejemplo, a partir de los correspondientes alcoholes por vía de tosilatos y ftalimidas [ver. J. Am. Chem. Soc., Vol. 117, p. 7025 (1995); WO 93/20804], por reducción de los correspondientes nitrilos [ver Heterocycles, Vol. 35, p. 2 (1993); Synthetic Commun. Vol. 25, p. 413 (1995); Tetrahedron Lett., p. 2933 (1995)], o aminación reductiva de cetonas [ver J. Am. Chem. Soc., Vol. 122, p. 9556 (2000); Org. Lett. p. 731 (2001); J. Med. Chem., p. 1566 (1988)], a partir de los correspondientes haluros [ver Synthesis, p. 150 (1995)] y, en caso dado, alquilación subsiguiente. La composición del grupo CR^1R^2 puede realizarse, en caso dado, mediante reacción de Grignard en los correspondientes nitrilos o anhídridos de ácido carboxílico [ver J. Org. Chem., p. 5056 (1992)]. Aminas de la fórmula III pueden ser preparadas también usando el método descrito en la WO 02/088125.

- Compuestos de la fórmula I, en la que X es ciano o alcoxi C_1-C_4 (fórmula I.B), pueden ser preparadas, ventajosamente, a partir de compuestos I, donde X es halógeno [Hal], preferentemente, cloro, que corresponden a la fórmula I.A.



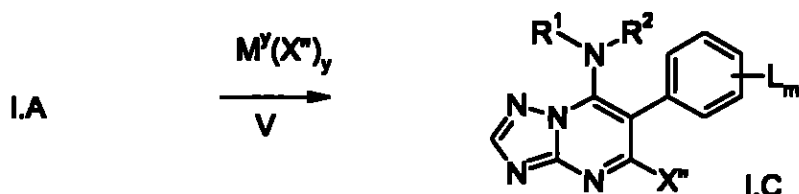
- Los compuestos I.A son transformados con los compuestos $M-X'$ (fórmula IV) en compuestos I.B. Los compuestos IV representan, dependiendo el significado del grupo X' a introducir, un cianuro inorgánico o un alcoxilato. La reacción se realiza, ventajosamente, en presencia de un disolvente inerte. El catión M en la fórmula IV tiene poca importancia, pero por razones prácticas se prefieren generalmente, sales de amonio, tetraalquilamonio o sales alcalinas o alcalinotérreas.

Generalmente, la temperatura de reacción varía de 0 a 120°C, preferentemente, de 10 a 40°C [ver J. Heterocycl. Chem., Vol.12, p. 861-863 (1975)].

Disolventes apropiados son: éteres, tales como dioxano, éter dietílico y, preferentemente tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados, como p.ej. diclorometano e hidrocarburos aromáticos, como p.ej. tolueno.

Compuestos I, donde X significa alquilo C₁-C₄ (fórmula I.C), pueden ser preparados, ventajosamente, partiendo de las sustancias de partida de la fórmula I.A mediante los métodos esbozados en lo sucesivo.

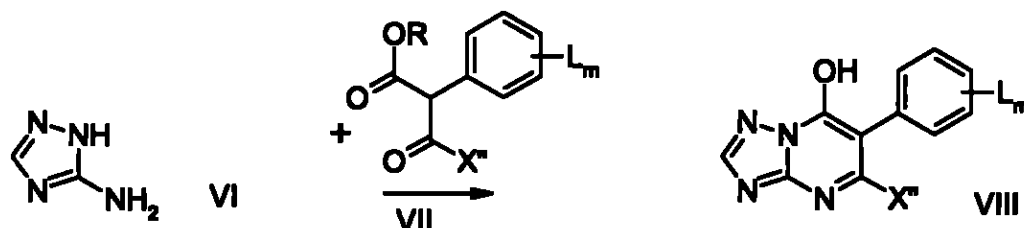
Compuestos de la fórmula I.C, donde Xⁿ significa alquilo C₁-C₄, pueden ser preparados por acoplamiento de 5-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula I.A con reactivos metálicos orgánicos de la fórmula V. En una variante de este procedimiento se efectúa la reacción bajo catálisis de un metal transitorio, como p.ej. Ni o Pd.



En la fórmula V, Xⁿ representa alquilo C₁-C₄ y M representa un ión de metal de la valencia Y, como por ejemplo, B, Zn o Sn. Esta reacción puede realizarse en analogía a los siguientes métodos: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), loc. cit. 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Vol. 43, p.733 (1990); J. Org. Chem., Vol. 43, p.358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. p.866 (1979); Tetrahedron Lett., Vol. 34, p.8267 (1993); loc. cit., Vol. 33, p.413 (1992).

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄ (fórmula I.C), se pueden preparar, ventajosamente, también mediante el siguiente método de síntesis:

- Partiendo de 5-aminotriazol VI y el ceto éster VII se obtienen las 5-alkil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas VIII. En la fórmula VII, R representa un grupo alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente, metilo o etilo. Usando los ésteres fenilacéticos fáciles de preparar VIIa donde $X''=CH_3$ se obtienen las 5-metil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas [ver Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. El 5-aminotriazol VI se obtiene en el comercio. Los compuestos de partida VII se preparan, ventajosamente, bajo las condiciones indicadas en la memoria EP-A 10 02 788.



10

Las 5-alkil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas VIII así obtenidas son transformadas con agentes de halogenación [HAL] en 7-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula IX.



- 15 Preferentemente, se usan agentes de cloración o bromación, tales como oxibromuro fosfórico, oxidloruro fosfórico, cloruro de tionilo o cloruro de sulfurilo. La reacción puede efectuarse en sustancia o en presencia de un disolvente. Las temperaturas de reacción usuales varían de 0 a 150°C o, preferentemente, de 80 a 125°C.

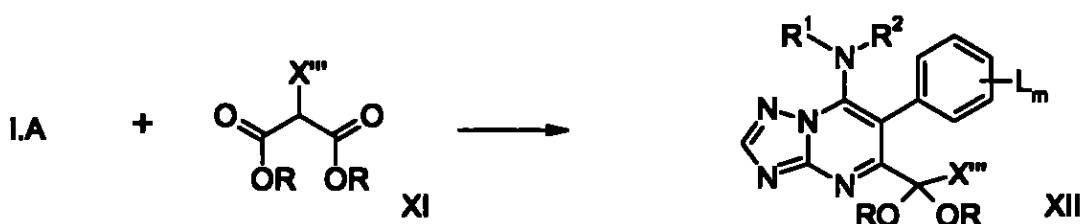


- 20 La reacción de IX con aminas III se efectúa, ventajosamente, a 0°C hasta 70°C, preferentemente, 10°C hasta 35°C, preferentemente, en presencia de un disolvente inerte, como p.ej. un éter, tal como dioxano, éter dietílico o, especialmente tetrahi-

dofurano, un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano y un hidrocarburo aromático, tal como tolueno [ver WO 98/46608].

Es preferible usar una base, por ejemplo, una amina terciaria, tal como trietilamina, o una base inorgánica, tal como carbonato de potasio, pero también se puede usar amina excesiva de la fórmula III como base.

Alternativamente, se pueden preparar los compuestos de la fórmula I.C, a partir de los compuestos I.A y malonatos de la fórmula XI. En la fórmula XI, X''' es hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃ y R significa alquilo C₁-C₄. Son transformados en compuestos de la fórmula XII y descarboxilados en compuestos I.C [ver US 5 994 360].



Los malonatos XI se conocen de la literatura [J. Am. Chem. Soc., Vol. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Vol. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Vol. 61, 1565 (1978)] o pueden ser preparados según la literatura citada.

La saponificación subsiguiente del éster XII se efectúa bajo condiciones generalmente conocidas; en función de los diferentes elementos estructurales puede ser ventajosa una saponificación alcalina o ácida de los compuestos XII. Bajo las condiciones de la saponificación de éster ya puede efectuarse parcialmente o completamente la descarboxilación en I.C.



La descarboxilación se realiza, generalmente, a temperaturas de 20°C a 180°C, preferentemente, 50°C a 120°C, en un disolvente inerte, en caso dado, en presencia de un ácido.

Ácidos apropiados son: ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido p-toluenosulfónico. Disolventes apropiados son: agua, hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano y petroléter, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, o, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados, tales como cloruro metilénico, cloroformo y clorobenceno, éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc.-butilmetílico, dioxano, anisol y tetrahidrofurano, nitrilos, tales como acetonitrilo y propionitrilo, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, dietilcetona y terc.-butilmetilcetona, alcoholes, tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y terc.-butanol, así como sulfoxido de dimetilo, dimetilformamida y dimetilacetamida, muy preferentemente, se realiza la reacción en ácido clorhídrico o ácido acético. Se pueden usar también mezclas de los disolventes mencionados.

Las mezclas de reacción suelen ser elaboradas ulteriormente de manera conocida, por ejemplo, mezclándolas con agua, separando las fases y purificando, opcionalmente, los productos crudos por cromatografía. Los productos intermedios y finales se obtienen, en parte, en forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente parduscos, que son librados de los componentes volátiles bajo presión reducida y a temperatura ligeramente elevada o purificados. Si los productos intermedios o finales se obtienen en forma de sólidos, entonces se puede purificarlos también por recristalización o digestión.

Si algunos de los compuestos I no pueden ser preparados mediante los métodos arriba descritos, entonces se puede obtenerlos por derivatización de otros compuestos I.

Si en la síntesis se obtienen mezclas isómeras, generalmente, no es necesario separarlas, ya que los diferentes isómeros pueden convertirse, en parte, durante la preparación para la aplicación o en la aplicación (p.ej. bajo la acción de la luz o de ácidos o bases) el uno en el otro. Conversiones correspondientes pueden tener lugar también en la aplicación, por ejemplo, en la planta misma o en el hongo nocivo a combatir cuando estos son tratados.

En las definiciones de los símbolos de las fórmulas arriba representadas se usaron términos colectivos representativos de los sustituyentes siguientes:

halógeno: fluoro, cloro, bromo y yodo;

5

alquilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales saturados con 1 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono, p.ej. alquilo C_1-C_8 , tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 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-metilpropilo;

10

15

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 2, 4 ó 6 átomos de carbono (como los arriba mencionados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los arriba mencionados: especialmente, halógenoalquilo C_1-C_6 , tales como 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, pentafluoroetilo ó 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

20

25

alquinilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales no saturados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en una posición arbitraria, p.ej. alquinilo C_2-C_8 , tales como: 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-

30

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 Si R^2 presenta un centro de quiralidad, entonces están incluidos en el ámbito de la invención los isómeros (R) y (S) y los racematos de los compuestos de la fórmula I.

Las variantes especialmente preferidas de los productos intermedios con respecto a las variables corresponden a aquellas de los radicales L_m , R^1 , R^2 y X de la fórmula I.

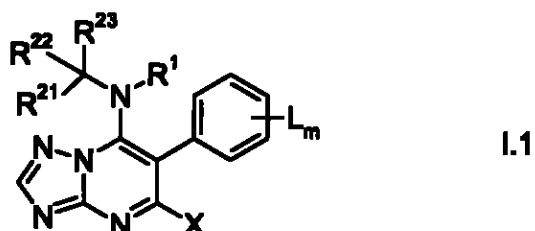
10

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

- 15 Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^1 significa hidrógeno.

También son preferidos los compuestos I, en los que R^1 significa metilo o etilo.

- 20 Un objeto preferido de la invención son los compuestos de la fórmula I, en los que el grupo R^2 presenta una ramificación en la posición α (fórmula I.1):



- 25 En esta fórmula, R^{21} significa metilo o halógenometilo, R^{22} es hidrógeno, metilo o halógenometilo y R^{23} significa alquilo C_2-C_8 , que puede ser no sustituido o estar parcial o completamente halogenado y/o llevar uno a tres grupos R^a . Las demás variables tienen las definiciones indicadas en la fórmula I.

Son especialmente preferidos los compuestos I.1, en los que R^{23} significa alquililo lineal o ramificado con 2 a 8 átomos de carbono, que puede ser no sustituido o es-

tar parcial o completamente halogenado y/o llevar uno a tres grupos alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono. Un objeto especial son los compuestos I, en los que R^{23} representa alquinilo lineal o ramificado con 2 a 8 átomos de carbono, que puede ser no sustituido o estar parcial o completamente halogenado

5

Otro objeto preferido de la invención son compuestos de la fórmula I, en los que R^2 significa uno de los grupos siguientes: $CH_2C \equiv CH$, $CH_2C \equiv CCH_3$,

$CH_2C \equiv CCH_2Cl$, $CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH_2CH_2C \equiv CH$, $CH_2CH_2C \equiv CCH_3$,

$CH_2CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2C \equiv CH$, $CH_2CH_2CH_2C \equiv CCH_3$,

10 $CH_2CH_2CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CH_3)C \equiv CH$, $CH(CH_3)C \equiv CCH_3$,

$CH(CH_3)C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CH_3)C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CH_3)CH_2C \equiv CH$,

$CH(CH_3)CH_2C \equiv CCH_3$, $CH(CH_3)CH_2C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CH_3)CH_2C \equiv CCH_2CH_3$,

$C(CH_3)_2C \equiv CH$, $C(CH_3)_2C \equiv CCH_3$, $C(CH_3)_2C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CF_3)C \equiv CH$,

$CH(CF_3)C \equiv CCH_3$, $CH(CF_3)C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CF_3)C \equiv CCH_2CH_3$, $CH(CF_3)CH_2C \equiv CH$,

15 $CH(CF_3)CH_2C \equiv CCH_3$, $CH(CF_3)CH_2C \equiv CCH_2Cl$, $CH(CF_3)CH_2C \equiv CCH_2CH_3$, cuyos grupos pueden ser no sustituidos o llevar uno a tres grupos R^a como sustituyentes.

Los compuestos de la fórmula I, en la que X significa halógeno, especialmente, cloro, (fórmula I.A), son otro objeto preferido de la invención.

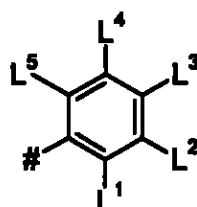
20

Son preferidos los compuestos I, en los que el índice m tiene el valor 1, 2 ó 3.

Son preferidos los compuestos I, en los que L_m significa fluoro, cloro, metilo, halógenoalquilo de C_1 , metoxi, amino, NHR o NR_2 , donde R es metilo o acetilo .

25

Además, son especialmente preferidos los compuestos I, en los que el grupo fenilo sustituido por L_m representa el grupo A



A

donde # es el lugar de enlace con el esqueleto de triazolopirimidina y

L^1 significa fluoro, cloro, CH_3 o CF_3 ;

L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno o fluoro;

5 L^3 es hidrógeno, fluoro, cloro, CH_3 , OCH_3 , amino, NHR o NR_2 ; y

L^5 es hidrógeno, cloro, fluoro o CH_3 .

10 Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que L_m significa una de las siguientes combinaciones de sustituyentes: 2-fluoro-6-cloro, 2,6-difluoro, 2,6-dicloro, 2-fluoro-6-metilo, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-metoxi, pentafluoro, 2-metil-4-fluoro, 2-trifluorometilo, 2-metoxi-6-fluoro, 2-cloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-cloro, 2-cloro-4-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-metilo, 2,4-dimetilo, 2-metil-4-cloro, 2-fluoro-4-metilo, 2,6-dimetilo, 2,4,6-trimetilo, 2,6-difluoro-4-metilo, 2-
15 trifluorometil-4-fluoro, 2-trifluorometil-5-fluoro o 2-trifluorometil-5-cloro.

20 Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que X significa halógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, como p.ej. cloro o metilo, especialmente, cloro.

25 Con respecto a su uso son especialmente preferidos los compuestos I resumidos en las Tablas siguientes. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente representan, además, por sí solos, independientemente de la combinación en que son mencionados, una variante especialmente preferida del respectivo sustituyente.

Tabla 1

30 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-fluoro-6-cloro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-dicloro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-fluoro-6-metilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,4,6-trifluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxi y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es pentafluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

30

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m 2-metil-4-fluoro y la combina-

ción de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 9

- 5 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-trifluorometilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 10

- 10 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-metoxi-6-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 11

- 15 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-cloro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 12

- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 13

- 25 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,4-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 14

- 30 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-fluoro-4-cloro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-cloro-4-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,3-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,5-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,3,4-trifluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-metilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25 Tabla 20

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,4-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

30 Tabla 21

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-metil-4-cloro y la combi-

nación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 22

- 5 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m 2-fluoro-4-metilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 23

- 10 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 24

- 15 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,4,6-trimetilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 25

- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metilo y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 26

- 25 Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, L_m 2-trifluorometil-4-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 27

- 30 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-5-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-5-cloro y la combinación de R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 29

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-5-ciano y la combinación de R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo y la combinación de R¹ y R² representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla A

No.	R ¹	R ²
A-1	H	CH ₂ C≡CH
A-2	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-4	H	CH ₂ C≡CCH ₃
A-5	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃
A-6	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃
A-7	H	CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-8	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-9	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-10	H	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-11	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-12	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-13	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-14	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-15	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-16	H	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-17	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-18	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-19	H	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-20	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-21	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-22	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-23	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-24	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-25	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-26	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-27	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-28	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-29	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-30	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-31	H	CH(CH ₃)C≡CH
A-32	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
A-33	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
A-34	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₃
A-35	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₃
A-36	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₃

No.	R ¹	R ²
A-37	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-38	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-39	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-40	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-41	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-42	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-43	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-44	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-45	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-46	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-47	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-48	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-49	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-50	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-51	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-52	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-53	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-54	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-55	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH
A-56	CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CH
A-57	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CH
A-58	H	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₃
A-59	CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₃
A-60	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₃
A-61	H	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-62	CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-64	H	CH(CF ₃)C≡CH
A-65	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CH
A-66	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CH
A-67	H	CH(CF ₃)C≡CCH ₃
A-68	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₃
A-69	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₃
A-70	H	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-71	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-72	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ Cl
A-73	H	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-74	CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-75	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)C≡CCH ₂ CH ₃
A-76	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CH
A-77	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CH
A-78	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CH
A-79	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-80	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-81	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-82	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-83	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-84	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ Cl
A-85	H	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-86	CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-87	CH ₂ CH ₃	CH(CF ₃)CH ₂ C≡ CCH ₂ CH ₃

Los compuestos I son apropiados como fungicidas. Se destacan por ser excelentemente efectivos contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, especialmente, de la clase de los *ascomycetos*, *deuteromicetos*, *oomycetos* y *basidiomicetos*. En parte son sistémicamente activos y pueden ser usados en la protección de plantas como fungicidas foliares y del suelo.

Son especialmente importantes para combatir múltiples hongos en diferentes plantas de cultivo, tales como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, plátanos, algodón, soya, café, caña de azúcar, vid, frutas y plantas de adorno y legumbres, tales como frijoles, tomates y cucurbitáceas, así como en las semillas de estas plantas.

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
- especies de *Bipolaris* y de *Dothidea* en cereales, arroz y césped,
- *Blumeria graminis* (oidio) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
- especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Plasmopara viticola* en 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, así como
- 5 • especies de *Venturia* (roña) en manzanas y peras.

Los compuestos I son apropiados, además, para combatir hongos nocivos, tales como *Paecilomyces variotii* en la protección de materiales (p.ej. madera, papel, dispersiones de pintura, fibras o bien tejidos) y en la protección de productos almacenados.

10

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.

15

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

20 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.

25

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.

30

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

5

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. También se pueden usar otros disolventes orgánicos como disolventes auxiliares, si se usa agua como diluyente. Auxiliares apropiados son, substancialmente: disolventes, tales como aromáticos (por ejemplo, xileno), aromáticos clorados (p.ej. clorobencenos), parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo, metanol, butanol), cetonas (por ejemplo, ciclohexanona), aminas (p.ej. etanolamina, dimetilformamida) y agua; 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

15

20

25

30

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, así como sus sales alcalinas y alcalinotérreas, sales de glicoléter de alcohol graso sulfatados, 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, tributilfenilpoliglicol éter, alquilarilpoliéter alcoholes, alcohol isotridecílico, 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 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, hidro-

5 carburos 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.

- 10 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 car-
- 15 gas 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 cor-
- 20 teza, 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
- 25 usan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, de 95% a 100% (según espectro de NMR).

Ejemplos de formulaciones son:

- 30 I. 5 partes en peso de un compuesto según la invención se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente particulado. De esta forma se obtiene un agente de espolvoreo que contiene 5% en peso del ingredien-

te activo.

- II. 30 partes en peso de un compuesto según la invención se mezclan íntima-
mente con una mezcla de 92 partes en peso de silicagel pulverulento y 8
partes en peso de aceite de parafina, que se ha pulverizado sobre la super-
ficie del silicagel. De esta forma se obtiene una preparación del ingrediente
activo con buena adherencia (contenido en ingrediente activo 23% en peso).
- III. 10 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en una
mezcla, que se compone de 90 partes en peso de xileno, 6 partes en peso
del producto de adición de 8 a 10 moles de óxido de etileno a 1 mol de N-
monoetanolamina de ácido oleico, 2 partes en peso de la sal cálcica del áci-
do dodecibencenosulfónico y 2 partes en peso del producto de adición de
40 moles de óxido de etileno en 1 mol de aceite de ricino (contenido en in-
grediente activo 9% en peso).
- IV. 20 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en una
mezcla, que se compone de 60 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes
en peso de isobutanol, 5 partes en peso del producto de adición de 7 moles
de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol y 5 partes en peso del producto
de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino (con-
tenido en ingrediente activo 16% en peso).
- V. 80 partes en peso de un compuesto según la invención se mezclan bien con
3 partes en peso de la sal sódica del ácido diisobutilnaftalin-alfa-sulfónico,
10 partes en peso de la sal sódica de un ácido ligninosulfónico de una lejía
residual sulfítica y 7 partes en peso de silicagel pulverulento y se muelen en
un molino de martillos (contenido en ingrediente activo 80% en peso).
- VI. Se mezclan 90 partes en peso de un compuesto según la invención con 10
partes en peso de N-metil- α -pirrolidona y se obtiene una solución apropiada
para ser aplicada en forma de gotas minúsculas (contenido en ingrediente

activo 90% en peso).

- VII. 20 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en una mezcla, que se compone de 40 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 20 partes en peso del producto de adición de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol y 10 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Vertiendo la solución en 100 000 partes en peso de agua y distribuyéndola finamente se obtiene una dispersión acuosa, que contiene 0,02% en peso del ingrediente activo.
- VIII. 20 partes en peso de un compuesto según la invención se mezclan bien con 3 partes en peso de la sal sódica del ácido diisobutilnaftalín- α -sulfónico, 17 partes en peso de la sal sódica de una lejía residual sulfítica y 60 partes en peso de silicagel pulverulento y se muelen en un molino de martillos. distribuyendo la mezcla finamente en 20000 partes en peso de agua, se obtiene un caldo de pulverización, que contiene 0,1% en peso del ingrediente activo.

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 rocío 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.

- 5 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%.

- 10 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.

- 15 A los ingredientes activos 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.

- 20 Cuando se usan como fungicidas, los fungicidas 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.

- 25 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:

- 30
- acilalaninas, tales como Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
 - derivados de amina, tales como Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenproplimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,

- anilino pirimidinas, tales como Pyrimetanil, Mepanipyrím o Cyrodlnyl,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomícina,
- azoles, tales como Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, 5 Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutria-
fol, Hexaconazol, Imazalilo, Metconazol, Myclobutanyl, Penconazol, Propiconazol, Procloroaz, Protioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- dicarboximidas, tales como Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- 10 • ditiocarbamatos, tales como Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbat, Thiram, Ziram, Zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como Anilazin, Benomilo, Boscalid, Carbendazim, carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanilo, Furametpir, Isoprothiolan, Mepronilo, 15 Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, pirfenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Siltiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, tiofanato-metilo, Tiadinyi, Tricyclazol, Triforine,
- fungicidas de cobre, tales como caldo de Bordeaux, acetato de cobre, ocloruro de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, nitroftal- 20 isopropilo,
- fenilpirroles, tales como Fenpiclonyl o Fludioxonyl,
- azufre,
- otros fungicidas, tales como Acibencenoar-S-metilo, Benthiavalicarb, Carpro-
pamid, clorothalonilo, Cyflufenamid, Cymoxanilo, Dazomet, diclomezin, diclo-
cymet, dietofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-acetato, Fe-
noxanyl, Ferimzone, Fluazinam, Fosetil, Fosetil-aluminio, Iprovalicarb, hexaclo-
robenceno, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, ftalida, Toloclofos-metilo, 25 Quintozene, Zoxamid,
- estrobilorinas, tales como Azoxistrobin, Dimoxistrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-
metilo, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxistrobin, Pyraclostrobin o Trifloxis-
trobin, 30

- derivados de ácido sulfénico, tales como Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid,
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como Dimetomorph, Flumetover o Flumorph.

5

Ejemplos de síntesis

Las prescripciones indicadas en los siguientes ejemplos de síntesis se pueden usar, variando en forma correspondiente los compuestos de partida, para la generación de otros compuestos I. Los compuestos así obtenidos se indican en las siguientes Tablas con sus datos físicos.

10

Ejemplo 1: Obtención de 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-propargilamino[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidina [I-1]

15

Una solución de 1,5 mmol de 5,7-dicloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina [ver WO 98/46807] en 20 ml de diclorometano se mezcló bajo agitación con una solución de 1,5 mmol de propargilamina y 1,5 mmol de trietilamina en 10 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó durante aprox. 16 horas a 20 – 25°C, luego se lavó con solución diluida de HCl. Después de la separación de las fases se secó la fase orgánica y se libró del disolvente. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 0,42 g del compuesto indicado en el título del p.f. 141 °C.

20

25 Ejemplo 2: Obtención de 5-ciano-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(N-metil-N-propargil-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

Una mezcla de 0,1 mol del compuesto I-2 y 0,25 mol de cianuro de tetraetilamonio en 750 ml de dimetilformamida (DMF) se agitó aprox. 16 horas a 20-25°C. Después de haber adicionado agua y éter metil-terc.-butilico (MTBE) y de haber separado las fases se lavó la fase orgánica con agua, luego se secó y se libró del disolvente .

30

Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 4,72 g del compuesto indicado en el título del p.f. 147 °C.

5 Ejemplo 3: Obtención de 5-metoxi-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(N-metil-N-propargilamino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

Una solución de 65 mmoles del compuesto I-2 en 400 ml de metanol anhidro se mezcló con 71,5 mmoles de solución de metanolato de sodio (al 30%) a 20-25°C. Después de haber agitado durante 16 horas a esta temperatura, se destiló el disolvente y se absorbió el residuo en diclorometano. Después de haber lavado la fase orgánica con agua se secó y luego se libró del disolvente. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 3,94 g del compuesto indicado en el título del p.f. 119 °C.

15 Ejemplo 4: Obtención de 5-metil-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(N-metil-N-propargilamino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

Una mezcla de 20 ml de malonato de dietilo y 0,27 g (5,65 mmoles) de hidruro sódico (dispersión al 50% dispersión en aceite mineral) en 50 ml de acetonitrilo se agitó a 20-25°C durante aprox. dos horas. Se adicionaron 4,7 mmoles del compuesto I-2 y luego se mezcló la mezcla durante aprox. 20 horas a 60°. Después de haber adicionado 50 ml de solución acuosa de cloruro de amonio se aciduló con solución diluida de HCl y luego se extrajo la mezcla con MTBE. Después del secado se libraron las fases orgánicas reunidas del disolvente. El producto crudo purificado por cromatografía en silicagel se absorbió en HCl. concentrado y luego se agitó la mezcla durante aprox. 24 horas a 80°C. Después del enfriamiento se reguló con solución acuosa de NaOH a un valor pH de 5 y se extrajo la mezcla de reacción con MTBE. Las fases orgánicas reunidas se libraron después del secado del disolvente. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 0,62 g del compuesto indicado en el título.

¹H-NMR (δ en ppm): 8,40 (s); 6,85 (m); 4,30 (d); 2,85 (s); 2,45 (s); 2,27 (s).

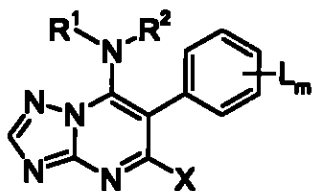


Tabla I

Nr.	R ¹	R ²	X	L _m	Datos físicos (p.f.. [°C])
I-1	H	CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	141
I-2	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	143
I-3	H	CH ₂ C≡CCH ₂ Cl	Cl	2,4,6-F ₃	173
I-4	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	227
I-5	H	CH ₂ C≡CH	Cl	2-Cl-6-F	190
I-6	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH	Cl	2-Cl-6-F	198
I-7	H	CH ₃ C≡CCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	210
I-8	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	153
I-9	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	66
I-10	H	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	149
I-11	H	CH(CH ₃)C≡CCH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	89
I-12	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	151
I-13	H	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	140
I-14	H	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	155
I-15	H	(CH ₂) ₃ C≡CH	Cl	2,4,6-F ₃	152
I-16	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2-CH ₃ -4-F	97
I-17	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2,4-F ₂	106
I-18	H	CH(CH ₃)C≡CH	Cl	2-Cl-4-F	108

Debido a la rotación inhibida del grupo fenilo pueden existir dos diastereómeros, que pueden diferenciarse en sus propiedades físicas.

5

Ejemplos de la acción contra hongos nocivos

El efecto fungicida de los compuestos de la fórmula I puede demostrarse mediante los ensayos siguientes:

Los ingredientes activos se prepararon separadamente o conjuntamente como solución madre con 0,25% en peso de ingrediente activo en acetona DMSO. A esta
5 solución se adicionó 1% en peso del emulsionante Uniperol® EL (humectante con efecto emulsionante y dispersante basado en alquifenoles etoxilados) y se diluyó con agua a la concentración deseada .

Ejemplo de aplicación 1 - Eficiencia contra marchitez temprana del tomate causada
10 por *Alternaria solani*

Las hojas de plantas de tomate de la variedad "Große Fleischtomate St. Pierre" fueron pulverizadas hasta chorrear con una suspensión acuosa con la concentración en principio activo abajo indicada. Al día siguiente, se infectaron las hojas con una
15 suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani* en 2 % de solución de biomalta con una densidad de $0,17 \times 10^8$ de esporas/ml. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 20 y 22°C. Después de 5 días la infección en las hojas de las plantas de control no tratadas pero infectadas se había desarrollado tan fuertemente, que pudo ser determinada
20 visualmente en %.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los ingredientes activos Nos. I-3 y I-4 presentaban una infestación de hasta un 3%, mientras que las plantas no trata-
das estaban infectadas en hasta un 80%.

25

Ejemplo de aplicación 2 – Eficiencia curativa contra la roya parda del trigo causada por *Puccinia recondita*

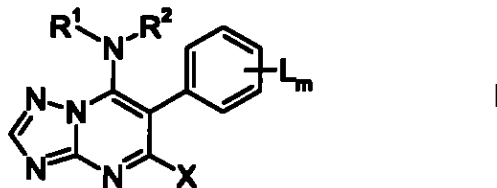
Las hojas de plántulas de trigo crecidas en macetas de la variedad "Kanzler" se
30 pulverizaron con esporas de la roya parda (*Puccinia recondita*). A continuación, se colocaron las macetas para 24 horas en una cámara con alta humedad del aire (90 a 95%) y de 20 a 22°C. Durante este tiempo las esporas germinaron y penetraron en el

24

- tejido de las hojas. Al día siguiente se pulverizaron las plantas infectadas hasta chorrear con una suspensión acuosa de la concentración abajo indicada . La suspensión o emulsión se preparó a partir de una solución madre con 10% de ingrediente activo en una mezcla compuesta de 89 % de acetona y 1 % de emulsionante. Después de estar seca la capa pulverizada se cultivaron las plantas de ensayo durante 7 días en el invernadero a temperaturas de entre 20 y 22°C y un 65 a 70 % de humedad relativa del aire. Entonces se determinó la extensión del desarrollo del hongo en las hojas.
- 5
- 10 En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los principios activos Nos. I-3 y I-4 presentaban menos de un 3% de infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 80

Reivindicaciones

1. 7-Alquinilamino-triazolopirimidinas de la fórmula I



5 en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

L significan, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, amino, NHR, NR₂, ciano, S(O)_nA¹ o C(O)A²,

10 R es alquilo C₁-C₈ o alquilcarbonilo C₁-C₈;

A¹ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₈, alquilamino C₁-C₈ o di-(alquil-C₁-C₈)-amino

15 n es 0, 1 ó 2;

A² es alquenilo C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, halógenoalcoxi C₁-C₈ o uno de los grupos mencionados para A¹;

20 m es 1, 2, 3, 4 ó 5, estando por lo menos un grupo L en posición orto frente al enlace con el esqueleto de triazolopirimidina;

X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halógenoalquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

25 R¹ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄;

R² es alquinilo C₃-C₁₀, que puede ser no sustituido o estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^o:

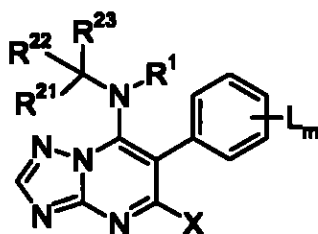
5 R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilcarbonilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxilo C_1-C_8 , halógenoalcoxilo C_1-C_8 , alcoxycarbonilo C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , alquilamino C_1-C_8 , di -alquilamino- C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , alqueniloxi C_2-C_8 , alquiniloxi C_3-C_8 o -cicloalquilo C_3-C_8 ,

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

10 R^b es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxilo, halógenoalcoxilo, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, 15 alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, cuyos grupos alquilo en estos radicales pueden contener 1 a 6 átomos de carbono y cuyos grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales pueden contener 2 a 8 átomos de carbono.

20

2. Compuestos de la fórmula I.1



I.1

en la que

25 R^{21} es metilo o halógenometilo;

R^{22} es hidrógeno, metilo o halógenometilo

R^{23} es alquínilo C_2-C_6 , que puede ser no sustituido o estar parcial o completamente halogenado y/o llevar uno a tres grupos;

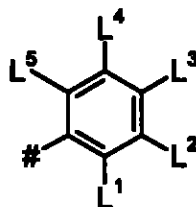
y las demás variables tienen las definiciones indicadas en la reivindicación 1.

5

3. Compuestos de la fórmula I o la fórmula I.1 según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde X es cloro o metilo, especialmente, cloro.

10

4. Compuestos de la fórmula I o I.1 según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa el grupo A



A

donde # es el lugar de enlace con el esqueleto de triazolopirimidina y

L^1 es fluoro, cloro, CH_3 o CF_3 ;

15

L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno o fluoro;

L^3 es hidrógeno, fluoro, cloro, CH_3 , OCH_3 , amino, NHR o NR_2 ; y

20

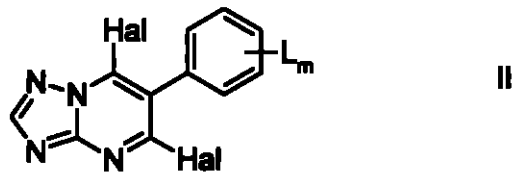
L^5 es hidrógeno, fluoro o CH_3 .

25

5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa una de las siguientes combinaciones de sustituyentes: 2-fluoro-6-cloro, 2,6-difluoro, 2,6-dicloro, 2-fluoro-6-metilo, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-metoxi, pentafluoro, 2-metilo-4-fluoro, 2-trifluorometilo, 2-Methoxy-6-fluoro, 2-cloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-cloro, 2-cloro-4-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-metilo, 2,4-dimetilo, 2-metilo-4-cloro, 2-fluoro-4-metilo, 2,6-dimetilo, 2,4,6-trimetilo, 2,6-

difluoro-4-metilo, 2-trifluorometilo-4-fluoro, 2-trifluorometilo-5-fluoro ó 2-trifluorometilo-5-cloro.

- 5 6. Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 a 5, haciendo reaccionar dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula II,



- 10 en la que las variables tienen los significados indicados para la fórmula I y Hal significa un átomo de halógeno, especialmente, cloro, con aminas de la fórmula III



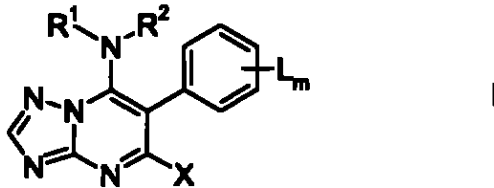
- 15 7. Producto apropiado para combatir hongos nocivos, que contienen un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.
8. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

7-Alquinilamino-triazolopirimidinas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para controlar hongos nocivos, así como productos que los contienen

Resumen

5

7-Alquinilamino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 L es halógeno, alquilo, halógenoalquil, alcoxi, Amino, NHR, NR₂, ciano, S(O)_nA¹ o C(O)A²,
 R es alquilo o alquilcarbonilo;
 A¹ es hidrógeno, hidroxí, alquilo, alquilamino o dialquilamino
 n 0, 1 ó 2;
- 15 A² es alquenilo, alcoxi, halógenoalcoxi o uno de los grupos mencionados para A¹;
- m es 1, 2, 3, 4 ó 5, estando por lo menos un grupo L en posición orto frente al enlace con el esqueleto de triazolopirimidina;
- 20 X es halógeno, Ciano, alquilo, halógenoalquilo o alcoxi;
- R¹ es hidrógeno o alquilo;
- 25 R² es alquinilo, que puede ser no sustituido o llevar uno de los sustituyentes mencionados en la descripción;

procedimientos para la obtención de estos compuestos, productos que los contienen, así como el uso de los mismos para combatir hongos nocivos.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/003346

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

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 A01N

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, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7 July 1993 (1993-07-07) cited in the application claim 1	1-8
X	WO 02/083676 A (BASF AG ; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMAN EBERHARD) 24 October 2002 (2002-10-24) claim 1	1-8
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8 April 1998 (1998-04-08) claim 1	1-8
X	WO 02/46195 A (BASF AG) 13 June 2002 (2002-06-13) claim 1	1-8
	-/-	

☒ 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 relating 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.
- "G" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 August 2004

Date of mailing of the international search report

06/09/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5618 Patentkan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Wolf, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/003346

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2 October 2003 (2003-10-02) claim 1	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/003346

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0550113	A	07-07-1993	EP 0550113 A2 07-07-1993
			EP 0782997 A2 09-07-1997
			GR 3033916 T3 30-11-2000
			AT 159256 T 15-11-1997
			AT 192154 T 15-05-2000
			AU 667204 B2 14-03-1996
			AU 3043592 A 01-07-1993
			BR 9205172 A 06-07-1993
			CA 2086404 A1 01-07-1993
			CN 1075144 A , B 11-08-1993
			CN 1141119 A , B 29-01-1997
			DE 69222746 D1 20-11-1997
			DE 69222746 T2 12-02-1998
			DE 69230977 D1 31-05-2000
			DE 69230977 T2 09-11-2000
			DK 550113 T3 09-02-1998
			DK 782997 T3 07-08-2000
			ES 2108727 T3 01-01-1998
			ES 2147411 T3 01-09-2000
			GR 3025920 T3 30-04-1998
			HK 1010105 A1 23-06-2000
			HU 63305 A2 30-08-1993
			IL 104244 A 13-07-1997
			JP 3347170 B2 20-11-2002
			JP 5271234 A 19-10-1993
			NZ 245581 A 26-07-1995
			PL 297160 A1 06-09-1993
			PL 171579 B1 30-05-1997
			PT 782997 T 29-09-2000
			RU 2089552 C1 10-09-1997
			SG 47563 A1 17-04-1998
			US 5593996 A 14-01-1997
			ZA 9210043 A 28-07-1993
WO 02083676	A	24-10-2002	BR 0208756 A 11-05-2004
			CA 2443696 A1 24-10-2002
			CZ 20032721 A3 14-01-2004
			EE 200300499 A 15-12-2003
			WO 02083676 A1 24-10-2002
			EP 1381609 A1 21-01-2004
			SK 12522003 A3 04-05-2004
			US 2004127509 A1 01-07-2004
EP 0834513	A	08-04-1998	US 5817663 A 06-10-1998
			AT 221069 T 15-08-2002
			DE 69714171 D1 29-08-2002
			DE 69714171 T2 12-12-2002
			EP 0834513 A2 08-04-1998
			JP 10152489 A 09-06-1998
			US 5965561 A 12-10-1999
WO 0246195	A	13-06-2002	WO 0246195 A1 13-06-2002
			AU 2362901 A 18-06-2002
			EP 1341794 A1 10-09-2003
			JP 2004515502 T 27-05-2004
WO 03080615	A	02-10-2003	WO 03080615 A1 02-10-2003

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003346

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D487/04 A01N43/90		
Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchierte Mindestprüfung (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 C07D A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1	1-8
X	WO 02/083676 A (BASF AG ; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMAN EBERHARD) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) Anspruch 1	1-8
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8. April 1998 (1998-04-08) Anspruch 1	1-8
X	WO 02/46195 A (BASF AG) 13. Juni 2002 (2002-06-13) Anspruch 1	1-8
	-/-	
☒ 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" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "I" 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 27. August 2004		Abgabedatum des internationalen Recherchenberichts 06/09/2004
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 851 epo nl Fax: (+31-70) 340-3018		Bevollmächtigter Beauftragter Wolf, C

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003346

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,X	WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) Anspruch 1	1-8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Akkordzeichen

PCT/EP2004/003346

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0550113 A	07-07-1993	EP 0550113 A2	07-07-1993
		EP 0782997 A2	09-07-1997
		GR 3033916 T3	30-11-2000
		AT 159256 T	15-11-1997
		AT 192154 T	15-05-2000
		AU 667204 B2	14-03-1996
		AU 3043592 A	01-07-1993
		BR 9205172 A	06-07-1993
		CA 2086404 A1	01-07-1993
		CN 1075144 A ,B	11-08-1993
		CN 1141119 A ,B	29-01-1997
		DE 69222746 D1	20-11-1997
		DE 69222746 T2	12-02-1998
		DE 69230977 D1	31-05-2000
		DE 69230977 T2	09-11-2000
		DK 550113 T3	09-02-1998
		DK 782997 T3	07-08-2000
		ES 2108727 T3	01-01-1998
		ES 2147411 T3	01-09-2000
		GR 3025920 T3	30-04-1998
		HK 1010105 A1	23-06-2000
		HU 63305 A2	30-08-1993
		IL 104244 A	13-07-1997
		JP 3347170 B2	20-11-2002
		JP 5271234 A	19-10-1993
		NZ 245581 A	26-07-1995
		PL 297160 A1	06-09-1993
		PL 171579 B1	30-05-1997
		PT 782997 T	29-09-2000
		RU 2089552 C1	10-09-1997
		SG 47563 A1	17-04-1998
		US 5593996 A	14-01-1997
		ZA 9210043 A	28-07-1993
WO 02083676 A	24-10-2002	BR 0208756 A	11-05-2004
		CA 2443696 A1	24-10-2002
		CZ 20032721 A3	14-01-2004
		EE 200300499 A	15-12-2003
		WO 02083676 A1	24-10-2002
		EP 1381609 A1	21-01-2004
		SK 12522003 A3	04-05-2004
		US 2004127509 A1	01-07-2004
EP 0834513 A	08-04-1998	US 5817663 A	06-10-1998
		AT 221069 T	15-08-2002
		DE 69714171 D1	29-08-2002
		DE 69714171 T2	12-12-2002
		EP 0834513 A2	08-04-1998
		JP 10152489 A	09-06-1998
		US 5965561 A	12-10-1999
WO 0246195 A	13-06-2002	WO 0246195 A1	13-06-2002
		AU 2362901 A	18-06-2002
		EP 1341794 A1	10-09-2003
		JP 2004515502 T	27-05-2004
WO 03080615 A	02-10-2003	WO 03080615 A1	02-10-2003

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: MIT DER INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN PRÜFUNG BEAUFTRAGTE BEHÖRDE

84

An:	Patente, Marken u. Lizenzen
BASF AKTIENGESELLSCHAFT D-67056 Ludwigshafen ALLEMAGNE	24. Feb. 2005

PCT

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG
DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN
BERICHTS ZUR PATENTIERBARKEIT
(Regel 71.1 PCT)

Absendedatum
(Tag/Monat/Jahr) 23.02.2005

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
0000054420

WICHTIGE MITTEILUNG

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003346

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)
30.03.2004

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
02.04.2003

Anmelder
BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.

PA gestellt 10.03.04 // T: NP 02.10.05

1. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Bericht zur Patentierbarkeit, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
2. Eine Kopie des Berichts wird - gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen - dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
3. Auf Wunsch eines ausgewählten Amtes wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.

4. ERINNERUNG

Zum Eintritt in die nationale Phase hat der Anmelder vor jedem ausgewählten Amt innerhalb von 30 Monaten ab dem Prioritätsdatum (oder in manchen Ämtern noch später) bestimmte Handlungen (Einreichung von Übersetzungen und Entrichtung nationaler Gebühren) vorzunehmen (Artikel 39 (1)) (siehe auch die durch das Internationale Büro im Formblatt PCT/IB/301 übermittelte Information).

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Bericht zur Patentierbarkeit enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu den maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Der Anmelder wird auf Artikel 33(5) hingewiesen, in welchem erklärt wird, daß die Kriterien für Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit, die im Artikel 33(2) bis (4) beschrieben werden, nur für die internationale vorläufige Prüfung Bedeutung haben, und daß "jeder Vertragsstaat (...) für die Entscheidung über die Patentfähigkeit der beanspruchten Erfindung in diesem Staat zusätzliche oder abweichende Merkmale aufstellen" kann (siehe auch Artikel 27(5)). Solche zusätzlichen Merkmale können z.B. Ausnahmen von der Patentierbarkeit, Erfordernisse für die Offenbarung der Erfindung sowie Klarheit und Stützung der Ansprüche betreffen.

Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde



Europäisches Patentamt
D-80298 München
Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx: 523856 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Ullrich, J
Tel. +49 89 2399-8048



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patents)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054420	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA18	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/003346	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 30.03.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 02.04.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04, A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 4 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☐ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um ☐ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enhalten, nur in computerisierter Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).		
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids ☐ Feld Nr. II Priorität ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☒ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 11.09.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 23.02.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx: 523856 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4485	Bevollmächtigter Bediensteter Wolf, C Tel. +49 89 2399-8285 	

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der Sprache beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der Bestandteile* der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(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 beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-25 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-8 in der ursprünglich eingereichten Fassung

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

82

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003346

Feld Nr. 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 1-8 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-8 |
| | Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-8 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)

und / oder

2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

siehe Beiblatt

Folgende Dokumente werden als nächster Stand der Technik zitiert:

- D1: EP-A-0 550 113 (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07)
D2: WO 02/083676 A (BASF AG ; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMAN EBERHARD) 24. Oktober 2002 (2002-10-24)
D3: EP-A-0 834 513 (AMERICAN CYANAMID CO) 8. April 1998 (1998-04-08)
D4: WO 02/46195 A (BASF AG) 13. Juni 2002 (2002-06-13)
D5: WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2. Oktober 2003 (2003-10-02)

Es wird angenommen, daß die Priorität gültig beansprucht wurde. In diesem Fall werden Dokumente wie D5, die zwischen dem Prioritätsdatum und dem Anmeldedatum der vorliegenden Anmeldung veröffentlicht wurden, im PCT-Verfahren nicht als Stand der Technik berücksichtigt (**Section VI**).

Im Lichte von D1-D4 erscheint der Anmeldungsgegenstand wie vorliegend beansprucht als neu im Sinne von Artikel 33(2) PCT und als erfinderisch im Sinne von Artikel 33(3) PCT (**Sektion V**).

D1-D2 offenbaren fungizide Verbindungen mit allgemeinen Formeln in den jeweiligen Ansprüchen 1, die mit der vorliegend beanspruchten allgemeinen Formel I überlappen. Jedoch kann die vorliegend beanspruchte Formel I als Auswahl der in D1-D4 offenbarten allgemeinen Formeln der Ansprüche 1 angesehen werden hinsichtlich des Substituenten R^2 , der laut Anspruchsbegehren nur ein substituiertes oder unsubstituiertes C_3 - C_{10} -Alkynyl sein kann. In D1-D4 wird explizit keine Verbindung offenbart, die an dieser Position einen Alkynylsubstituenten trägt.

Die der vorliegenden Anmeldung zugrundeliegende technische Aufgabe war die Bereitstellung weiterer Fungizide.

Die Anmelderin hat mittels Vergleichstests mit Verbindungen aus D4 die verbesserte Wirkung der anmeldungsgemässen Verbindungen im Vergleich zu einigen aus D4 bekannten demonstriert, die sich im besagten Alkynylsubstituenten unterscheiden.

Refno Folio 84 "Extracto"

Expediente No			No de Folio
Item		No de unidades	
1	CD		✓
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	X	✓
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones: *este final*

8790
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 05111856 00000000 Folios: 91
Fecha (AMD): 2005-11-02 17:44:54
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 83.443
FECHA : NOVIEMBRE 1 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	27496707	01/11/2005	44,080,880.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	443,000.00
		TOTAL :	\$ 443,000.

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

06 00361-811.061-1

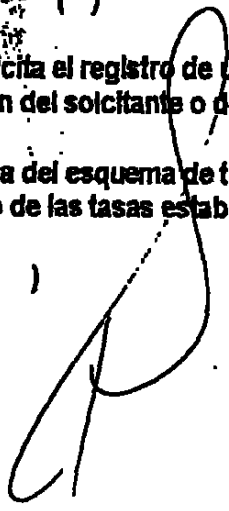
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 05111856 00000000
Fecha (MM): 2005-11-02 17:44:54
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION <i>pct</i> MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	(X)
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	(X)
- Descripción de la invención.	()	(X)
- Dibujos de ser estos pertinentes.	()	(X)
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.		
COMPLETA (X)	INCOMPLETA ()	()
DISEÑO INDUSTRIAL ()		
- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	(X)	()
- 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:



92

Folio _____

2020
Bogotá DC

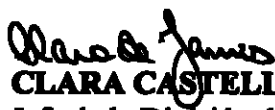
Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA:	Radicación No.	05-111856
	Solicitud Internacional	PCT/EP2004/003346
	Fecha inicio fase nacional	02-11-2005
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	890
	Folios	001

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

26 DIC 2005


CLARA CASTELLANOS DE JAIMES
Jefe de la División de Nuevas Creaciones (E)

202030