



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

05-110738

54. TITULO

**7-MALQUILAMINO-TRIAZOLOPIRIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU
OBTENCION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA CONTROLAR HONGOS
NOXIOS, 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.,



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Indicacion : 05110/38 00000000 Folioms 1,33
Fecha (Giro): 2005-10-31 17:01:01
Folio : 011 PCY-PATENT 379 PAGE MACI 411 PRESENIAC
Dependencia: 2005 DIVISION DE NUEVAS INVENTIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

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

2
S LICITANTE
(71)

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

Dirección: Carl-Bosch-Straße
67056 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

Domicilio: Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____

Número _____

3
REPRESENTANTE
O AP DERADO

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

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____

Número 438.019 T.P 31.929

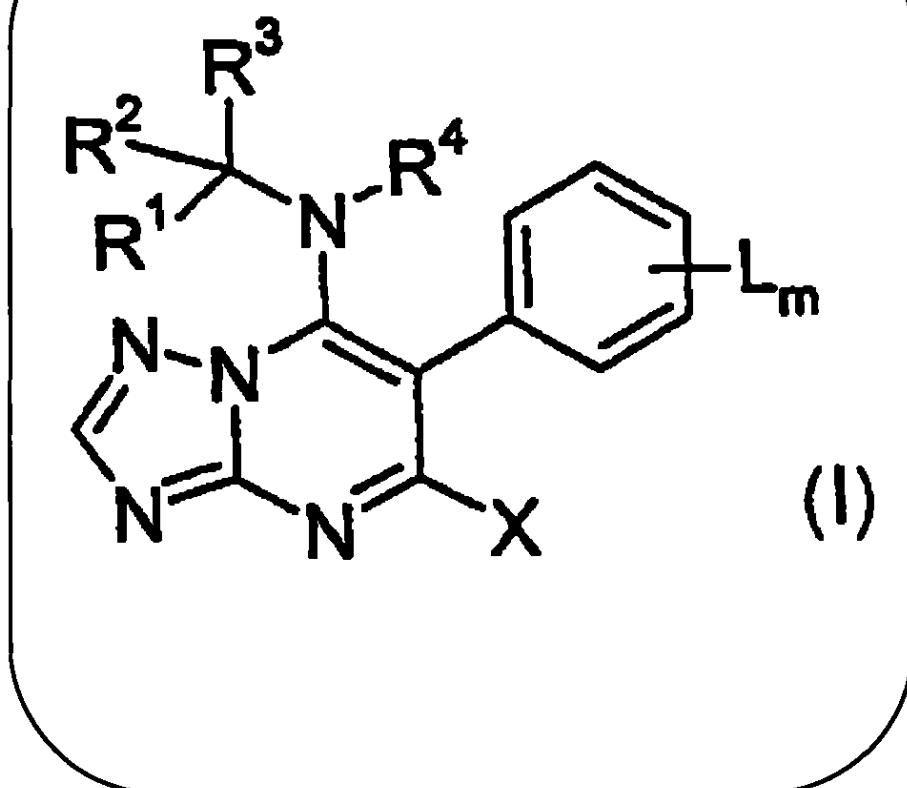
4
INVENTOR (ES)
(72)

- | | |
|--|---|
| 1. Jordi TORMO I BLASCO
Carl-Benz-Str.10-3,
69514 Laudenbach,
República Federal de Alemania | 9. Peter SCHÄFER
Römerstr. 1,
67308 Ottersheim,
República Federal de Alemania |
| 2. Carsten BLETNER
Richard-Wagner-Str.48,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania | 10. Frank SCHIEWECK
Lindenweg 4,
67258 Hessheim,
República Federal de Alemania |
| 3. Bernd MÜLLER
Stockingerstr. 7,
67227 Frankenthal,
República Federal de Alemania | 11. Anja SCHWÖGLER
Heinrich-Lanz-Str.3,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania |
| 4. Markus GEWEHR
Goethestr. 21,
56288 Kastellaun,
República Federal de Alemania | 12. Maria SCHERER
Hermann-Jürgens-Str.30,
76829 Landau,
República Federal de Alemania |
| 5. Wasillios GRAMMENOS
Alexander-Fleming-Str. 13,
67071 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania | 13. Siegfried STRATHMANN
Donnersbergstr. 9,
67117 Limburgerhof
República Federal de Alemania |
| 6. Thomas GROTE
Im Höhnhausen 18,
67157 Wachenheim,
República Federal de Alemania | 14. Ulrich SCHÖFL
Erlenstrasse. 8,
68782 Brühl,
República Federal de Alemania |
| 7. Andreas GYPSE
B4.4,
68159 Mannheim,
República Federal de Alemania | 15. Reinhard STIERL
Jahnstr.8,
67251 Freinsheim,
República Federal de Alemania |
| 8. Joachim RHEINHEIMER
Merziger Str.24,
67063 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania | |

5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/003102</u> Fecha: <u>24 de marzo de 2004</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2004/087705 A1</u> Fecha: <u>14 de octubre de 2004</u>		
6	TÍTULO (54) <u>7 - ALQUENILAMINO-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>31/03/2003</u>
			(31) Número de Solicitud <u>103 14 760.8</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>05-81.651/81.652</u> Fecha: <u>24 de octubre 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:

Emilio Ferrero
C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

4

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2004/087705 A1**

Descripción:

Páginas 33 en el idioma original

Páginas 41 en español

Reivindicaciones: Número (s) 9

Figuras: Número (s)

2. ☐ **Forma PCT/RO/101. PCT Request**
3. ☐ **Request for correction under Rule 92bis**
4. ☐ **Forma PCT/RO/106. Invitation to Correct Defects.**
5. ☒ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**
6. ☐ **Forma PCT/ISA/220. Notificación De La Transmisión Del Informe De Búsqueda Internacional Y De La Opinión Escrita De La Administración Encargada De La Búsqueda Internacional, O De La Declaración.**
7. ☐ **Forma PCT/ISA/237. Opinión Escrita De La Administración Encargada De La Búsqueda Internacional.**
8. ☐ **Forma PCT/IB/304. Notification Concerning Submission Or Transmittal Of Priority Document.**
9. ☐ **Forma PCT/IB/306. Notification Of The Recoding Of A Change.**
Descripción De Modificación:

10. ☐ **Forma PCT/IB/308. Notice Informing The Applicant Of The Communication Of The International Application To The Designated Offices.**
11. ☐ **Forma PCT/IB/332. Information Concerning Elected Offices Notified Of Their Election.**
12. ☐ **FORMA PCT/IB/345. Communication in cases for which no other form is applicable.**

13. ☐ **Forma PCT/IPEA/401. PCT Demand**
14. ☐ **Forma PCT/IPEA/402. Notification Of Receipt Of Demand By Competent International Preliminary Examining Authority.**
15. ☐ **Forma PCT/IPEA/408. Written Opinion.**
16. ☒ **Forma PCT/IPEA/416. Notification Of Transmittal Of The International Preliminary Examination Report.**
17. ☒ **Forma PCT/IPEA/409. Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
18. ☐ **Traducción Al Español Del Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
19. ☐ **Traducción Al Español De Los Anexos Presentados Junto Con El Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
20. ☒ **Extracto de publicación.**

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

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

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 833; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 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 haya de reemplazar al primero, o al 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 enseñas; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistír, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos hechos por agentes oficiales.

Dado y firmado hoy **17 de marzo de 1989**

en **D-6700 Ludwigshafen**

BASF Aktiengesellschaft

[Firma]
ppa. Welzel

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

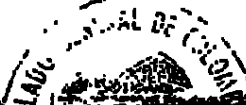
wohnhaft in **Ludwigshafen, República Federal de Alemania**

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 833; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, das 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 auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten, oder Kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenige eines Stellvertreters, oder dritten Vertreters, beziehungsweise, dass einer oder anderen, ordnungsgemäss die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund der auszuföhen, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder dritten Stellvertreter beziehungsweise. Ausserdem, und unter diesem Befehl, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte, die Vollmacht und den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb zu dem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen, und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Sammel-, Defensive- und Servicezeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen- und zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Names und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertraglizenzen; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorrichtungsmaßnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am **17. März 1989**

in **D-6700 Ludwigshafen**

[Unterschrift]
ppa. Richters



U.R.Nr. 1407/89

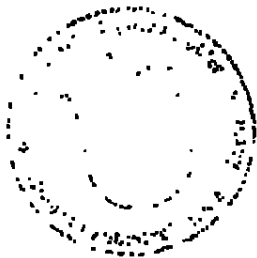
Ich beglaubige hiermit die Echtheit der vorst.
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren:

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

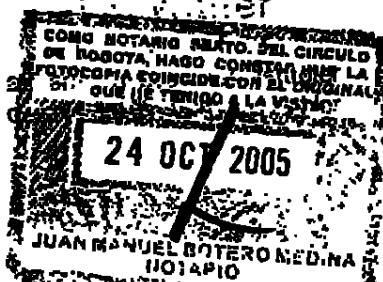
Die Herren Dr. Welzel und Dr. Richters sind mir persönlich
bekannt.

Aufgrund heutiger Einsichtnahme in das Handelsregister
beim Amtsgericht Ludwigshafen am Rhein HR B 3000 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]



Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

Thomas W a l t e r

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

[Handwritten signature: Franz Serfas]
(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM

LUZ ARRIAGA DE M. PENA
JURISTEN
T. 100 20 20 1
Bonn, 555 555 555



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

C E R T I F I C A:

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

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

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

Frankfurt a. M. 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por \$43.60 de Ley E. S. N. N.



M-0077

Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

SECRET

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES

Según 12 ABR. 1989 No. 8

MADE MONTER

En el día
Cartha Nino
cuyo firma aparece en el pie del presente
documento, otorgado en ese fecha
las funciones del notario

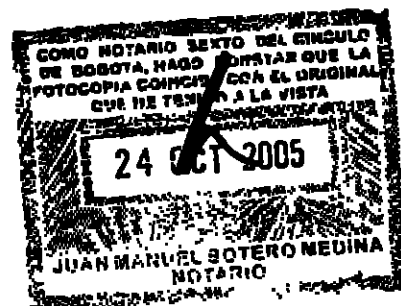
COMO NOTARIO SEÑTO DEL CIRCULO
DE PODERES, HAGO CONSTAR QUE LA
COPIA QUE SE PRESENTA CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

24 OCT 2005

MANUEL P. ROMERO
SECRETARIO

Manuel P. Romero
MANUEL P. ROMERO ACURA
Notario General

SECRET



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.



COMO NOTARIO SUETO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

24 OCT 2005

JUAN ANTONIO OTERO MEDINA
NOTARIO

2
8

TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

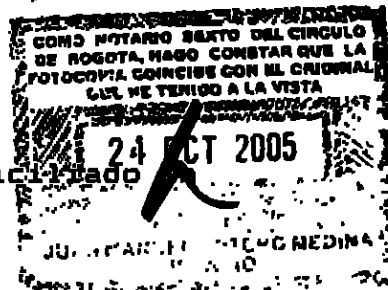
de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

(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. 1407/89

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

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

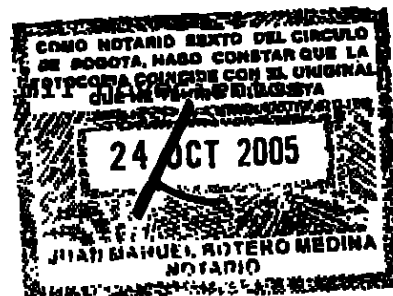
Notario de Ludwigshafen

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 ochenta y nueve



LUZ ARRIAGA DE HEBER
TRADUCTORA INTERPRETE OFICIAL
Cesal-clín No. 599 Minustalia

10

El Presidente del Tribunal Regional

Fdp.: 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 bajo 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 OFICIAL

Luz Arriaga de Herben

Relación No. 24 OCT 2005

NOTARIO SEPTO DEL CIRCULO
EL CUAL HA CONSTATADO QUE LA
FOTOCOPIA CONCIERDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

24 OCT 2005

MANUEL ROYER MEDINA
NOTARIO

05 AGO. 1999

SANTAFE DE BOGOTA

NOTARIA BOGOTA
BLOMBENDEZ
BOGOTA

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá 28/BR/1983 No. 89045

HACE CONSTAR

Que el señor LUIZ DE HEER
cuya firma aparece al pie del presente
documento, desempeñaba en esa fecha
las funciones allí indicadas.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

24 OCT 2005

JUAN MANUEL SOTERO MELINA
NOTARIO

Encargado

Encargado

CAVELIER

ABOGADOS

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

12
CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO (57) (1) 2120100
CABLES: CAVELEYES

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

Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

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

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

Señor Jefe,


GERMAN CAVELIER

T.P.A. No.

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

Acepto:


EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-780-2

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2282 de 1985)

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

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 672991
expedida en UJAQU 94 y la tarjeta profesional
número 31.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: R.D. MURRAY (NOMBRE)
y declaró que la firma que aparece en el es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2282 de 1985)

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

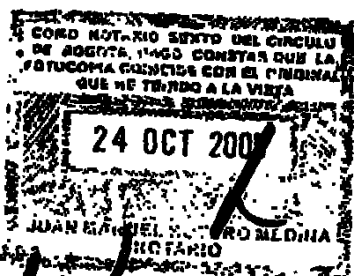
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 207794
expedida en 26 y la tarjeta profesional
número 637 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación
y declaró que la firma que aparece en él es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



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

Colombia

55-5 / 3

0000054413

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 Hohnhausen 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 Hefenheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

Anja Schwöglér /
 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-Alquienilamino-triazolo-
 pirimidinas, procedimientos para su obtención y
 el uso de los mismos para controlar plagas
 nocivas, así como productos que los contienen

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída 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-(Alkenylamino)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.

Dado y firmado hoy

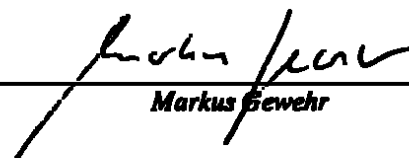
Given and signed this

18. März 2004,

15

Firma

Signature


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

Anja Schwöglers

Anja Schwöglers

Maria Scherer

Maria Scherer

Siegfried Strathmann

Siegfried Strathmann

Ulrich Schöff

Ulrich Schöff

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

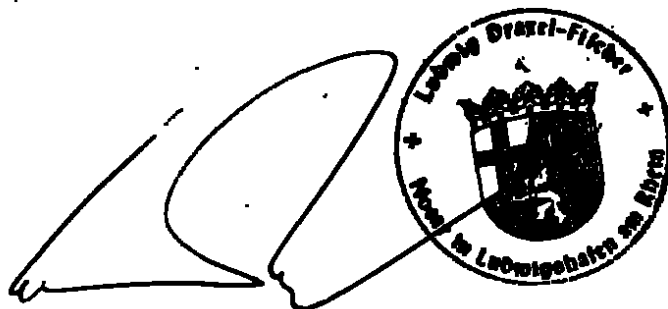
before me, a Notary Public at Ludwigshafen,
Federal Republic of Germany

compareció(eron) personalmente

personally appeared Jordi Tormo i Blasco,
Carsten Blettner, Bernd Müller, Markus
Gewahr, 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 has (have)
legal capacity to execute it.



Notario Público

Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

CAVELIER ABOGADOS
WFFODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

Urk.R.Nr. 515/2004

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

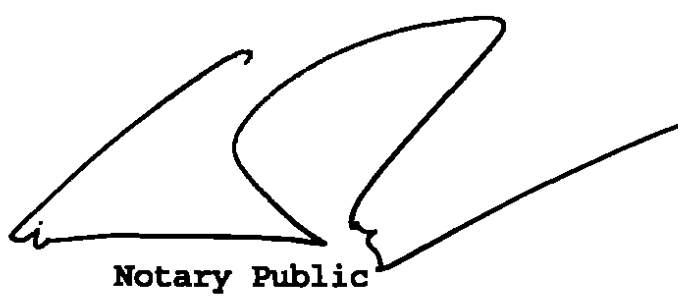
1. Mr. Jordi Tormo i Blasco, residing at Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Germany, personally known to me,
2. Mr. Carsten Blettner, residing at Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
3. Mr. Bernd Müller, residing at Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
4. Mr. Markus Gewähr, 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 Hohnhausen 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 LandgerichtKostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 09.14/05a 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 Schwögl, 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 mismos 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

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 Schwöglar, 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. 515/2004

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 Schwögl, 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

Firma Ilegible

Oblea

Notario Público

24
24

(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-007081/WPCL002G/COLO 00361-841-059-5

Cns C-2005-00009972

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

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

Diego Lopez
Josep Serrano

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA SANTA FE DE BOGOTA, 19 SEP 2005



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 SEP 19 P 12:19

nos
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTA FE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

160359
Diego Lopez
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

TRADUCCION OFICIAL No. 10928

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

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

Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach
Alemania
Ciudadano de España
Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Bernd Müller
Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal
Alemania
Ciudadano de Alemania
Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Alemania
Ciudadano de Alemania
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Grecia
Thomas Grote
Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Andreas Gypser -
B 4, 4, 68159 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Alemania
Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Alemania

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
[Firma]
Resolución No.599 Minjusticia

26

2

Ciudadano de Alemania
Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Alemania

Ciudadano de Alemania
Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Alemania

Ciudadano de Alemania
Maria Scherer Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau
Alemania

Ciudadano de Alemania
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Alemania

Ciudadano de Alemania
Ulrich Schöff
Luftschiffing 22c, 68782 Brühl
Alemania

Ciudadano de Alemania
Reinhard Stierl
Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

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

7-(Alquenilamino)triazolopirimidinas, preparaciones para su obtención y el uso de las mismas para controlar hongos nocivos, así como productos que los contienen

y ceden sin limitación a la sociedad BASF AKTIENGESSELLSCHAFT, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Dado y firmado el 6 de noviembre de 2003. Hay quince firmas ilegibles de los mencionados señores.

Certificación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 18 de marzo de 2004.

bajo el No. 515/2004.- (Hilo y oblea notarial en relieve). – Valor 5.112,92 €

LUZ ARRIAGA DE HENRIK
TRADUCTORA / INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

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 del notario Draxel-Fischer, notario de Ludwigshafen am Rhein

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 23 de marzo de 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, 13 de septiembre de 2005.

C. 2655

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA JURÍDICA OFICIAL
Resolución No. 384 de 1994

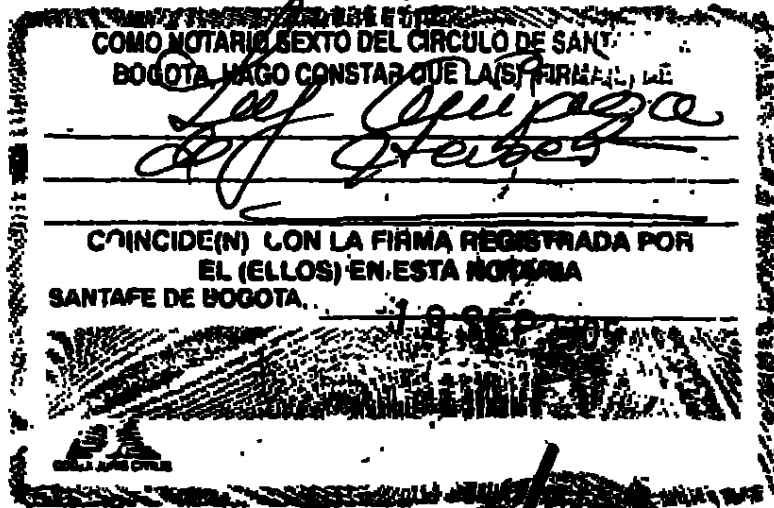
MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

160360
Luz Arango
CUIA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 SEP 19 P 12:20

Luz
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.



(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



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

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/087705 A1

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/003102

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. März 2004 (24.03.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 14 760.8 31. März 2003 (31.03.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BASF AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE];
67065 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO,
Jordi [ES/DE]; Karl-Benz-Str. 10-3, 69514 Landenbach
(DE). BLETNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wag-
ner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd
[DE/DE]; Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal (DE).
GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288
Kastellmann (DE). GRAMMENOS, Wasilios [GR/DE];
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).
GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hühnenhausen, 67157

Wachenheim (DE). GYPSE, Andreas [DE/DE]; B 4.4,
68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim
[DE/DE]; Merzger Str. 24, 67063 Ludwigshafen
(DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr. 1, 67308
Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE];
Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER,
Anja [DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
(DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jör-
gens-Str.30, 76829 Landau (DE). STRATHMANN,
Stegfried [DE/DE]; Donnersbergstr. 9, 67117 Limburg-
erhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlenstrasse 8,
68782 Brühl (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.
8, 67251 Feinsheim (DE).

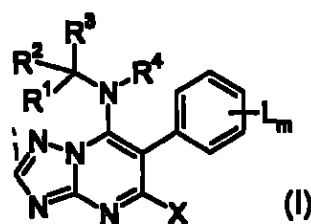
(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGES-
SELLSCHAFT; 67065 Ludwigshafen (DE).

(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, FR, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KR,
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.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 7-ALKENYLAMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE
THEREOF IN CONTROLLING HARMFUL FUNGI AND SUBSTANCES CONTAINING SAID TRIAZOLOPYRIMIDINES

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



(57) Abstract: The invention relates to 7-alkenylamino-triazolopyrimidines of formula (I) wherein the substituents have the following meaning: L represents halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, amino, NHR or NR; R represents alkyl or alkyl-carbonyl; m represents 1, 2, 3, 4 or 5; X represents halogen, cyano, alkyl, halogenalkyl or alkoxy; R¹ represents alkyl or halogenalkyl; R² represents hydrogen, alkyl or halogenalkyl; R³ represents alkenyl which is unsubstituted or partially or totally halogenated or can be substituted according to the description; R⁴ represents hydrogen or alkyl, R³ and R⁴ can form, together with the nitrogen atom whereon they are bound, a five or six-membered unsaturated ring which can be interrupted by an atom from the groups O, N and S and/or can include one or several substituents.

The invention also relates to methods for producing said compounds, agents containing said compounds and the use thereof in controlling plant pathogenic harmful fungi.

(57) Zusammenfassung: 7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel (I) in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: L Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Amino, NHR oder NR; R Alkyl oder Alkyl carbonyl; m 1, 2, 3, 4 oder 5; X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl oder Alkoxy; R¹ Alkyl oder Halogenalkyl; R² Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl; R³ Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder gemäß der Beschreibung substituiert sein kann; R⁴ Wasserstoff oder Alkyl, R³ und R⁴ können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten tragen kann; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2004/087705 A1



(84) *Bestimmungsorten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart):* ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), arabisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (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

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.

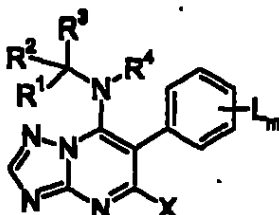
30

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

Beschreibung

5

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



In der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 10 L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂,

R C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl;

- 15 m 1, 2, 3, 4 oder 5;

X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;

R¹ C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl;

20

R² Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl;

R³ C₂-C₁₀-Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann:

25

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy, C₁-C₈-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₈-Alkylthio, C₁-C₈-Alkylamino, Di-C₁-C₈-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Alkinyloxy oder C₃-C₈-Cycloalkyl,

30

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

35

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Amino-carbonyl, Amino-thiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino,

Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

R^4 Wasserstoff oder C_1 - C_2 -Alkyl,

R^3 und R^4 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der einen oder mehrere Substituenten R^5 tragen kann.

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

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.

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.

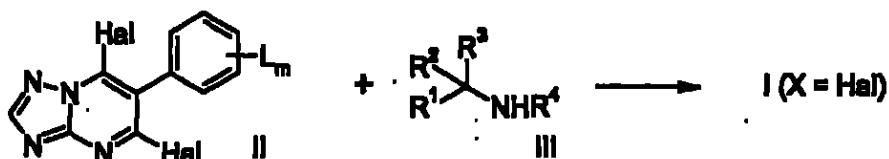
Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch die Ausgestaltung der Alkenylgruppe in der 7-Position des Triazolopyrimidin-Gerüsts, die am α -C-Atom eine Verzweigung aufweist.

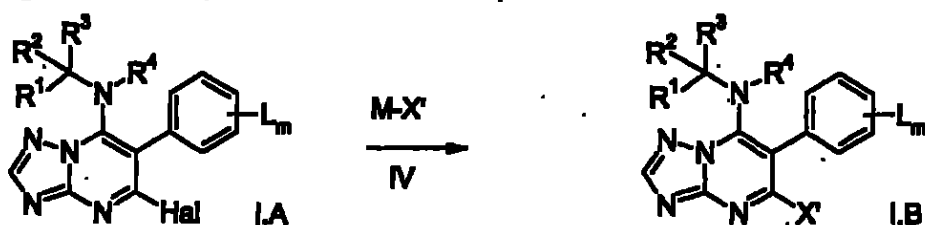
Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

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.



- 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.
- 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.
- 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. 2833 (1995)], oder reduktive Aminierung von Ketonen [vgl. J. Am. Chem. Soc., Bd. 122, S. 9558 (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 CR¹R² kann gegebenenfalls durch Grignard-Reaktion an entsprechenden Nitrilen oder Carbonsäureanhydriden erfolgen [vgl. J. Org. Chem., S. 5058 (1992)]. Amine der Formel III sind auch auf dem aus WO 02/088125 bekannten Weg zugänglich.
- Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen, insbesondere Chlor, steht (Formel I.A), sind ein bevorzugter Gegenstand der Erfindung.
- Verbindungen der Formel I, in der X Cyano oder C₁-C₆-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.



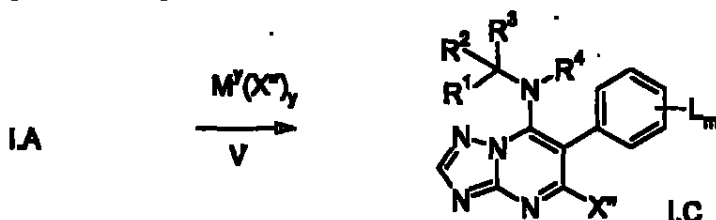
- Verbindungen I.A werden mit Verbindungen M-X' (Formel IV) zu Verbindungen I.B umgesetzt. Verbindungen IV stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel IV hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.

Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-883 (1975)].

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

- Verbindungen der Formel I.C, in denen X^m C₁-C₄-Alkyl bedeutet, können durch Kuppelung von 5-Halogentriazolopyrimidinen 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.

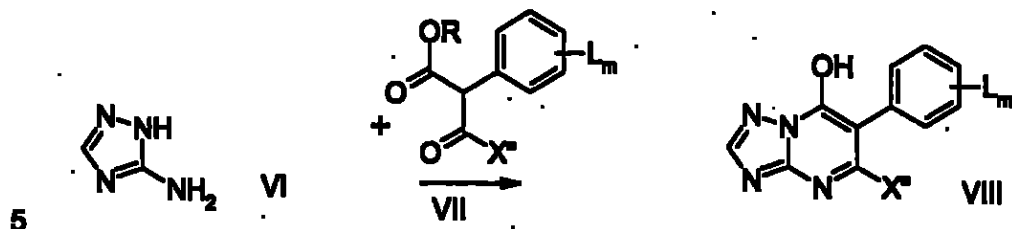


- In Formel V steht X^m für C₁-C₄-Alkyl und M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, S.733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, S.358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. S.886 (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:

- Ausgehend von 5-Aminotriazol VI und dem Ketoester VII werden die 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 zugängli-

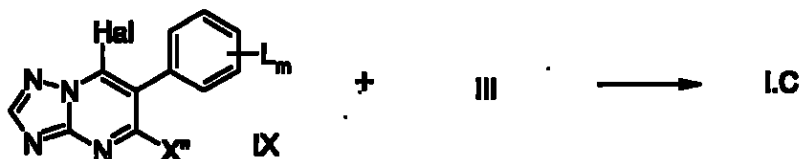
chen 2-Phenylacetessigestern VIIa mit $X''=CH_3$ werden die 5-Methyl-7-hydroxy-8-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1981)]. 5-Aminotriazol VI ist kommerziell erhältlich. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen VII erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 bekannten Bedingungen.



Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-8-phenyltriazolopyrimidine VIII werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel IX umgesetzt.



- 10 Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxylbromid, Phosphoroxylchlorid, 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.



- 15 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].

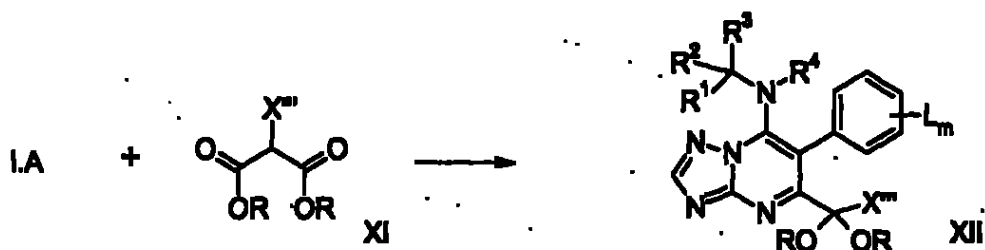
20

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.

25

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, C_1-C_3 -Alkyl oder C_1-C_3 -Halogenalkyl und R C_1-C_4 -Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel XII umgesetzt und zu Verbindungen I.C decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].

35



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.

15

Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petroether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylglykoxal, Diethylketon und tert-Butylmethylether, 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

30

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.

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

- 5 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
10 der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schädpliz erfolgen.

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

15

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- 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,
20 Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 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;
25

- Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: Insbesondere C₁-C₈-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;
30

35

- Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₈-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Me-
40

37
37

- thyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Alkenylen: ungesättigte, geradkettige Kohlenwasserstoffreste mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindungen in beliebiger Position.

- 20 Sofern R^1 und R^2 verschieden sind, stellt das die Gruppen R^1 bis R^3 tragende C-Atom ein Chiralitätszentrum dar. In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate der Verbindungen der Formel I eingeschlossen.

- 25 Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L_m , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und X der Formel I.

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:

- 30 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R^1 für Methyl oder Halogenmethyl, wie Trifluormethyl, steht.

- Ein weiterer bevorzugter Gegenstand sind Verbindungen I, in denen R^2 Wasserstoff ist.

- 35 Bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^3 für geradkettiges oder verzweigtes C_2 - C_{10} -Alkenyl 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^3 für geradkettiges oder verzweigtes C_2 - C_{10} -Alkenyl steht, welches unsubstituiert ist.
- 40

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^3 und R^4 gemeinsam eine C_2-C_4 -Alkanylenkette bilden, die durch eine oder zwei Methyl- oder Halogenmethylgruppen substituiert sein kann.

5

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 Wasserstoff bedeutet.

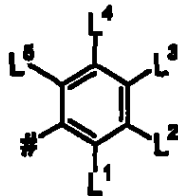
Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^4 für Methyl oder Ethyl steht.

- 10 Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen mindestens eine Gruppe L orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst steht; insbesondere solche, 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,

- 15 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

- 20 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;

25

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

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

- 30 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-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.
- 35

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen X Halogen oder C₁-C₄-Alkyl, wie Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

- 5 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.

10

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-chlor und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dichlor und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-methyl und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trifluor und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methoxy und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

40

40

Tabelle 7

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

5

Tabelle 8

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

10

Tabelle 9

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

15

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methoxy-8-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 11

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

25

Tabelle 12

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

30

Tabelle 13

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

35

Tabelle 14

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

40

Tabelle 15

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

5

Tabelle 16

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

10

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,5-Difluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 18

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

20

Tabelle 19

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

25

Tabelle 20

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

30

Tabelle 21

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

35

Tabelle 22

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

40

Tabelle 23

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dimethyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 24

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trimethyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 26

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

20

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle A

Nr.	R^1	R^3	R^4
A-1	CH_3	$CH=CH_2$	H
A-2	CH_3	$CH=CH_2$	CH_3
A-3	CH_3	$CH=CH_2$	CH_2CH_3
A-4	CH_3	$C(CH_3)=CH_2$	H
A-5	CH_3	$C(CH_3)=CH_2$	CH_3
A-6	CH_3	$C(CH_3)=CH_2$	CH_2CH_3

Nr.	R ¹	R ²	R ⁴
A-7	CH ₃	CH=CHCH ₃	H
A-8	CH ₃	CH=CHCH ₃	CH ₃
A-9	CH ₃	CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-10	CH ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	H
A-11	CH ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-12	CH ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	H
A-14	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-15	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-16	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-17	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-18	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-19	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-20	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-21	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-22	CH ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H
A-23	CH ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
A-24	CH ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-25	CH ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	H
A-28	CH ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-27	CH ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-28	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H
A-29	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-30	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-31	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	H
A-32	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-33	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-34	CH ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	H
A-35	CH ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-36	CH ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃

44
47

Nr.	R ¹	R ²	R ⁴
A-37	CH ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	H
A-38	CH ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	CH ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-40	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	H
A-41	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-42	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-43	CH ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-44	CH ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-45	CH ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-46	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-47	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-48	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-49	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-50	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-51	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-52	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-53	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-54	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-55	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-56	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-57	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-58	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-59	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-60	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-61	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-62	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-63	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-64	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-65	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-66	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ⁴
A-67	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-68	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-69	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-71	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-72	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-74	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-75	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-76	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-77	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-78	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-80	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-81	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-82	CH ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H
A-83	CH ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃
A-84	CH ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-85	CH ₃	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#	
A-86	CH ₃	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#	
A-87	CH ₃	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#	
A-88	CH ₃	-CH=CHCH ₂ -#	
A-89	CH ₃	-CH=CHCH(CH ₃)-#	
A-90	CF ₃	CH=CH ₂	H
A-91	CF ₃	CH=CH ₂	CH ₃
A-92	CF ₃	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-93	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	H
A-94	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-95	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-96	CF ₃	CH=CHCH ₃	H

46
40

Nr.	R ¹	R ²	R ³
A-97	CF ₃	CH=CHCH ₃	CH ₃
A-98	CF ₃	CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-99	CF ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	H
A-100	CF ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-101	CF ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-102	CF ₃	CH=C(CH ₃) ₂	H
A-103	CF ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-104	CF ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-105	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-106	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-107	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-108	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-109	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-110	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-111	CF ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H
A-112	CF ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
A-113	CF ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-114	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	H
A-115	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-116	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-117	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H
A-118	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-119	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-120	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	H
A-121	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-122	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-123	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	H
A-124	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-125	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-126	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	H

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴
A-127	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-128	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-129	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	H
A-130	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-131	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-132	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-133	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-134	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-135	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-136	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-137	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-138	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-139	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-140	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-141	CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-142	CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-143	CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-144	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-145	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-146	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-147	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-148	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-149	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-150	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-151	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-152	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-153	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-154	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-155	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-156	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H

47

47

48
48

Nr.	R ¹	R ²	R ³
A-157	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-158	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-159	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-160	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-161	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-162	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-163	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-164	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-165	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-166	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-167	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-168	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-169	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-170	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-171	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H
A-172	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃
A-173	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-174	CF ₃	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#	
A-175	CF ₃	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#	
A-176	CF ₃	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#	
A-177	CF ₃	-CH=CHCH ₂ -#	
A-178	CF ₃	-CH=CHCH(CH ₃)-#	
A-179	CH ₂ F	CH=CH ₂	H
A-180	CH ₂ F	CH=CH ₃	CH ₃
A-181	CH ₂ F	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-182	CH ₂ F	C(CH ₃)=CH ₂	H
A-183	CH ₂ F	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-184	CH ₂ F	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-185	CH ₂ F	CH=CHCH ₃	H
A-186	CH ₂ F	CH=CHCH ₃	CH ₃

49
49

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴
A-187	CH ₂ F	CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-188	CH ₂ F	CH=CHCH ₂ CH ₃	H
A-189	CH ₂ F	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-190	CH ₂ F	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-191	CH ₂ F	CH=C(CH ₃) ₂	H
A-192	CH ₂ F	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-193	CH ₂ F	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-194	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-195	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-196	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-197	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-198	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-199	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-200	CH ₂ F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H
A-201	CH ₂ F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
A-202	CH ₂ F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-203	CH ₂ F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	H
A-204	CH ₂ F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-205	CH ₂ F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-206	CH ₂ F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H
A-207	CH ₂ F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-208	CH ₂ F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-209	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	H
A-210	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-211	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-212	CH ₂ F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	H
A-213	CH ₂ F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-214	CH ₂ F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-215	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	H
A-216	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴
A-217	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-218	CH ₃ F	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	H
A-219	CH ₃ F	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-220	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-221	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-222	CH ₃ F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-223	CH ₃ F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-224	CH ₃ F	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-225	CH ₃ F	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-226	CH ₂ F	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-227	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-228	CH ₃ F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-229	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-230	CH ₃ F	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-231	CH ₂ F	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-232	CH ₂ F	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-233	CH ₃ F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-234	CH ₃ F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-235	CH ₂ F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-236	CH ₃ F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-237	CH ₂ F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-238	CH ₃ F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-239	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-240	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-241	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-242	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-243	CH ₃ F	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-244	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-245	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-246	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃

50

50

Nr.	R ¹	R ²	R ³
A-247	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-248	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-249	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-250	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-251	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-252	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-253	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-254	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-255	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-256	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-257	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-258	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-259	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-260	CH ₂ F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H
A-261	CH ₂ F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃
A-262	CH ₂ F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-263	CH ₂ F	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#	
A-264	CH ₂ F	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#	
A-265	CH ₂ F	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#	
A-266	CH ₂ F	-CH=CHCH ₂ -#	
A-267	CH ₂ F	-CH=CHCH(CH ₃)-#	

kennzeichnet die Bindung zu dem Stickstoffatom

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 Gemüse.

seepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 5 • *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,
- 10 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- 15 • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 20 • *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

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

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

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

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

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

- 10 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.

- 15 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, 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 Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

- 30 Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, 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.

5 Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieseldl, ferner Kohlentseröle 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.

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

15 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.

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

Beispiele für Formulierungen sind:

30 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 Wirkstoffe enthält.

35 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 Wirkstoffe mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

40 III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 8 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8

ble 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Tellen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Tellen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

- 5 IV. 20 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gew.-Tellen Cyclohexanon, 30 Gew.-Tellen Isobutanol, 5 Gew.-Tellen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isocetylphenol und 5 Gew.-Tellen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

10

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

15

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

20

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

25

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

30

- 35 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Ver-

56

56

wendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

5 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netz-
baren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet wer-
den. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub-
stanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber
10 auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und even-
tuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Ver-
dünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in
größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und
15 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

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

20 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 erfindunge-
gemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

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

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

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin,
Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
- 40 • Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,

57

- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
 - Azole wie Bitterianol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Fluallazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
 - Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
 - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
 - Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thlabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
 - Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
 - Nitrophenylderivate wie Blnapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-Isopropyl,
 - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
 - Schwefel,
 - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthialvalcarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomazin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluznam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalcarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid,
 - Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxm-methyl, Metomnastrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
 - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofuanid, Folpet, Tolyfluanid,
 - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.
- 30 **Synthesebeispiele**

Die in dem nachstehenden Synthesebeispiel wiedergegebene Vorschrift wurde unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

35

Beispiel 1 - Herstellung von 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(1-methyl-2-propen-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-1]

5 Eine Lösung von 1,5 mmol 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin [vgl. WO 98/46807] in 20 ml Dichlormethan wurde unter Rühren mit einer Lösung von 1,5 mmol (1-Methyl-2-propen-1-yl)amin [vgl. US 4 120 901; J. Chem. Soc., Chem. Commun., S. 794 (1984)] 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
10 getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 0,52 g der Titelverbindung vom Fp. 101 °C.

Beispiel 2 - Herstellung von 5-Cyano-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(2,5-dimethylpyrrodo-3-en-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

15 Eine Mischung von 0,1 mol der Verbindung I-10 und 0,25 mol Tetraethylammoniumcyanid 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
20 4,32 g der Titelverbindung vom Fp. 206 °C.

Beispiel 3 - Herstellung von 5-Methoxy-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(2,5-dimethylpyrrodo-3-en-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

25 Eine Lösung von 65 mmol der Verbindung I-10 in 400 ml wasserfr. Methanol wurde mit 71,5 mmol Natriummethanolat-Lösung (30%lg) 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
30 erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 4,05 g der Titelverbindung vom Fp. 149 °C.

Beispiel 4 - Herstellung von 5-Methyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(2,5-dimethylpyrrodo-3-en-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

35 Eine Mischung von 20 ml Diethylmalonat und 0,27 g (5,85 mmol) Natriumhydrid (50% Dispersion in Mineralöl) in 50 ml Acetonitril wurde bei 20-25°C etwa 2 Std. gerührt. 4,7 mmol der Verbindung I-10 wurden zugesetzt, dann wurde die Mischung bei 60°C
40 etwa 20 Std. gerührt. Nach Zusatz von 50 ml wässr. Ammoniumchlorid-Lösung wurde

57
59

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
- 5 mit wässer. NaOH-Lösung ein pH-Wert von 5 eingestellt und die Reaktionsmischung mit 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.
- 10 ¹H-NMR (δ in ppm): 8,42 (s); 6,85 (m); 5,75 (s); 4,75 (q); 2,42 (s); 1,10 (s).

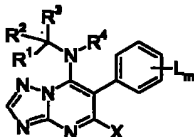


Tabelle I

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	L _m	phys. Daten (Fp. [°C])
I-1	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	101
I-2	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	154
I-3	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2,4,6-F ₃	88
I-4	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	143
I-5	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2,4,6-F ₃	127
I-6	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	115
I-7	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	105
I-8	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-Cl-6-F	131
I-9	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2,6-F ₂	143
I-10	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2,4,6-F ₃	105
I-11	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2,4-F ₂	118
I-12	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2,4-F ₂	111
I-13	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-Cl	151
I-14	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-F	149
I-15	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	98
I-16	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	121
I-17	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	85

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	L _m	phys. Daten (Fp. [°C])
I-18	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	105
I-19	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	128
I-20	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2,4-F ₂	72
I-21	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2,4-F ₂	92
I-22	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2,4-F ₂	72
I-23	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	80
I-24	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	72
I-25	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2-Cl-4-F	98
I-26	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	132
I-27	CH ₃	H	CH=CH ₂	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	158
I-28	CH ₃	H	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	91
I-29	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	119
I-30	CH ₃	H	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#		Cl	2,4,6-F ₃	151
I-31	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	107
I-32	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-CH ₃ -4-F	183
I-33	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	118
I-34	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2,4-F ₂	90
I-35	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	98

kennzeichnet die Bindung zu dem Stickstoffatom

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

Beispiele für die Wirkung gegen Schädlinge

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

5

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam 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

10

Wasser verdünnt.

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

15

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 Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^8$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen

20

hatte sich der Blattbefall auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

25

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. I-1, I-5 und I-7 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprika blättern verursacht durch *Botrytis cinerea*

30

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die $1,7 \times 10^8$ Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthält, inokuliert. Anschließend wurden die

35

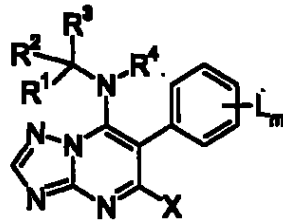
Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

40

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. I-1, I-5 und I-7 behandelten Pflanzen bis zu 3% Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.

Patentansprüche

1. 7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel I



5 In der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂,

10 R C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl;

m 1, 2, 3, 4 oder 5;

X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

15

R¹ C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl;

R² Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl;

20

R³ C₂-C₁₀-Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann:

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy, C₁-C₈-Alkoxy carbonyl, C₁-C₈-Alkylthio, C₁-C₈-Alkylamino, Di-C₁-C₈-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Alkinyloxy oder C₃-C₈-Cycloalkyl,

25

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

30

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,

35

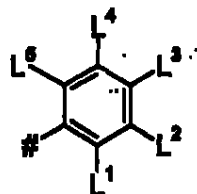
35

Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten;

R^4 Wasserstoff oder C_1 - C_2 -Alkyl,

R^3 und R^4 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der einen oder mehrere Substituenten R^5 tragen kann.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der R^1 Methyl oder Halogenmethyl bedeutet.
4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der R^2 Wasserstoff bedeutet.
5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, in der 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;

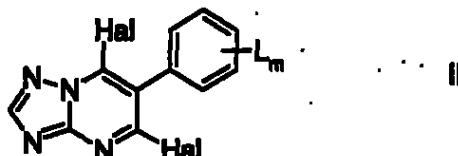
L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH_3 , OCH_3 , Amino, NHR oder NR_2 ; und

L^5 Wasserstoff, Fluor oder CH_3 bedeuten.

6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für eine der folgenden Substituentenkombinationen

nen 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.

7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 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.



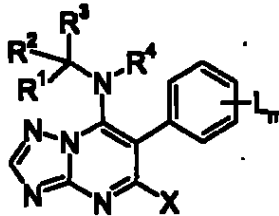
8. Zur Bekämpfung von Schädipflanzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.
9. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schädipflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden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

7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine, Verfahren zu Ihrer Herstellung und Ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Zusammenfassung

5

7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 L Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂; R Alkyl oder Alkyl-carbonyl; m 1, 2, 3, 4 oder 5;

X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl oder Alkoxy;

15 R¹ Alkyl oder Halogenalkyl;

R² Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl;

20 R³ Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder gemäß der Beschreibung substituiert sein kann;

R⁴ Wasserstoff oder Alkyl,

25 R² und R⁴ können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten tragen kann;

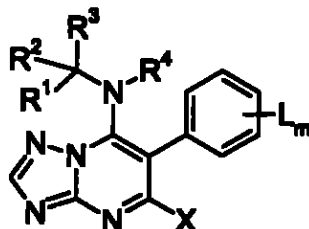
30 Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

7-Alquenilamino-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-alquenilamino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 L significan, independientemente, halógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₁-C₈-alcoxi, amino, NHR o NR₂,

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

- 15 m es 1, 2, 3, 4 ó 5;

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

R¹ es alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃;

20

R² es hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃;

R³ es alquenilo C₂-C₁₀, que puede ser no sustituido o parcial o completamente sustituido o llevar uno a tres grupos R^a:

25

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxil, -alquilcarbonilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈, halógenoalcoxi C₁-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₈, -alquiltio C₁-C₈, alquilamino C₁-C₈, di -alquilamino C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alquililoxi C₃-C₈ o -cicloalquilo C₃-C₈,

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

5 R^b es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquinioloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, cuyos grupos alquilo en estos radicales pueden contener 1 a 6 átomos de carbono y cuyos grupos alquenilo o alquinioloxi mencionados en estos radicales pueden contener 2 a 8 átomos de carbono;

15 R^d es hidrógeno o alquilo C_1-C_2 ,

R^a y R^d también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo no saturados de cinco o seis miembros, que puede llevar uno o varios sustituyentes R^e .

20

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.

25 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 por objeto proveer compuestos con efecto mejorado y/o espectro de acción más amplio

30

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.

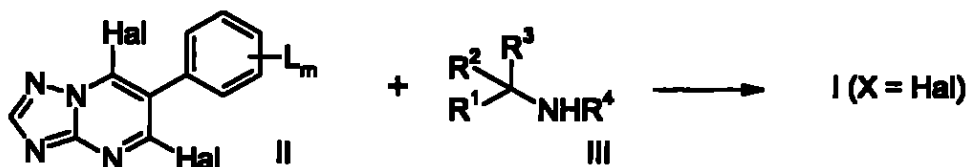
5

Los compuesto de la fórmula I se diferencian de los compuestos indicados en las memorias arriba mencionadas en la forma del grupo alquenilo en la posición 7 del esqueleto de triazolopirimidina, que en el átomo α -C- presenta una ramificación.

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

Los compuestos de la invención pueden ser preparados mediante diferentes métodos. Ventajosamente, se preparan por reacción de

15 dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula II, donde Hal significa un átomo de halógeno, como p.ej. bromo o, especialmente, cloro, con aminas de la fórmula III bajo las condiciones generalmente conocidas de la WO 98/46608.



20

La reacción de II 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 dioxano, éter dietílico o, especialmente, tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados, como p.ej. diclorometano e

25 hidrocarburos aromáticos, como p.ej. tolueno.

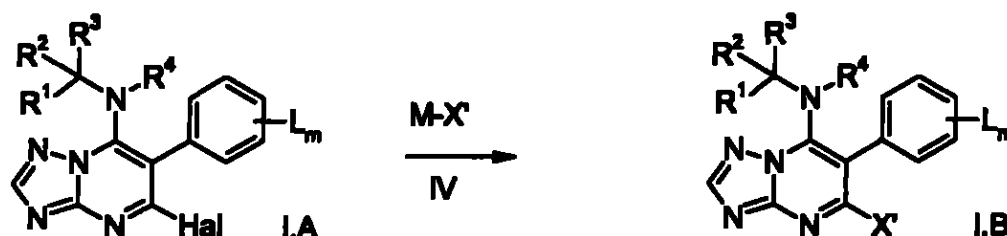
Es preferible usar una base, p.ej. una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o una base inorgánica, como p.ej. carbonato de potasio; también se puede usar amina excesiva de la fórmula III como base.

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

- 5 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 CR¹R²
10 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.

- 15 Compuestos de la fórmula I, en la que X significa halógeno, especialmente, cloro (fórmula I.A), son un objeto preferido de la presente invención.

- Compuestos de la fórmula I, en la que X significa ciano o alcoxil C₁-C₃ (fórmula I.B),
20 pueden prepararse, ventajosamente, a partir de compuestos I, donde X es halógeno [Hal], preferentemente, cloro, que corresponden a la fórmula I.A.



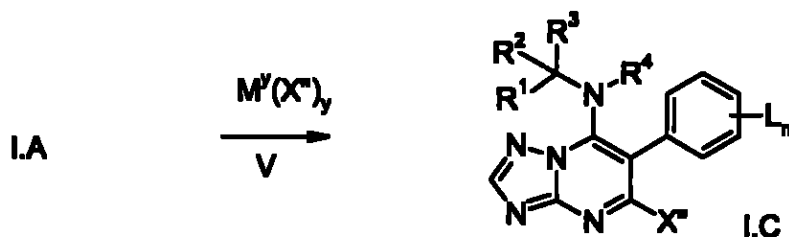
- Compuestos I.A son transformados con compuestos M-X' (fórmula IV) en
compuestos I.B. Compuestos IV representan, dependiendo del significado del grupo
25 X' a introducir, un cianuro inorgánico o un alcoxilato. La reacción se efectúa, ventajosamente, en presencia de un disolvente inerte. El catión M en la fórmula IV tiene poca importancia, pero por razones prácticas son generalmente preferidas las sales de amonio, tetraalquilamonio o las sales de metal alcalino o alcalinotérreo.

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.

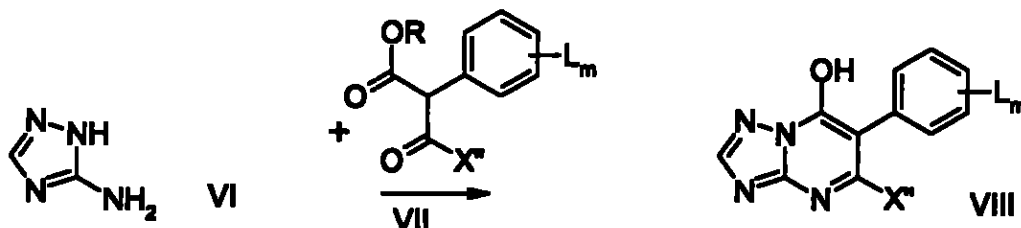
Compuestos de la fórmula I.C, donde X^m significa alquilo C₁-C₄, pueden ser preparado por acoplamiento de 5-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula I.A con reactivos metálicos orgánicos de la fórmula V. En una variante de este procedimiento se efectúa la reacción bajo catálisis de un metal transitorio,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



En la fórmula V, X^m 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.



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



Preferentemente, se usan agentes de cloración o bromación, tales como oxibromuro fosfórico, oxiclورو fosfórico, clورو de tionilo o clورو 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.

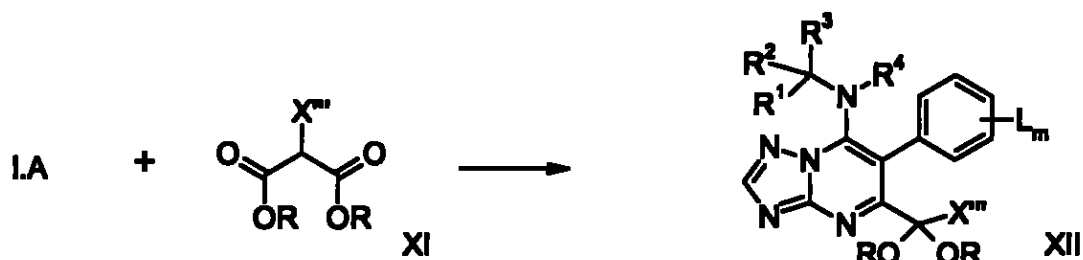


La reacción de IX con aminas III se efectúa, ventajosamente, a 0°C hasta 70°C, preferentemente, 10°C hasta 35°C, preferentemente, en presencia de un disolvente inerte, como p.ej. un éter, tal como dioxano, éter dietílico o, especialmente

tetrahidrofurano, 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 sulfóxido 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.

75

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 C₁-C₈, 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 C₁-C₂, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, 20 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 alqueno: radicales hidrocarburo ramificados o lineales no saturados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en una posición arbitraria, p.ej. alqueno C₂-C₈, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-

30

propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

alquenileno: radicales hidrocarburo lineales no saturados con 3 ó 4 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria.

Si R^1 y R^2 son radicales diferentes, entonces el átomo de carbono que lleva los grupos R^1 a R^3 representa un centro de quiralidad. La presente invención abarca 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 , R^3 , R^4 y X de la fórmula I.

En cuanto al uso de las triazolopirimidinas de la fórmula I son preferidos los siguientes significados de los sustituyentes, tanto por si solas como también en combinaciones

Son preferidos los compuestos I, en los que R^1 significa metilo o halógenometilo, como p.ej. trifluorometilo.

Otro objeto preferidos son los compuestos I, en los que R^2 significa hidrógeno.

Son preferidos los compuestos I, en los que R^3 significa alquenilo C_2-C_{10} , lineal o ramificado, que puede ser no sustituido o parcial o completamente sustituido y/ o llevar uno a tres grupos alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono. Un objeto especialmente preferido son los compuestos I, en los que R^3 significa alquenilo
5 lineal o ramificado con 2 a 10 átomos de carbono, que puede ser sustituido.

Son igualmente preferidos los compuestos I, en los que R^3 y R^4 forman juntos una cadena de alquenileno con 3 a 4 átomos de carbono, que puede estar sustituida por uno o dos grupos metilo o halógenometilo.

10

Son especialmente preferidos los compuestos I preferentemente, en los que R^4 significa hidrógeno.

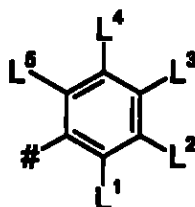
También son preferidos los compuestos I, en los que R^4 significa metilo o etilo.

15

Son preferidos los compuestos I, en los que por lo menos un grupo L está en posición orto con respecto al lugar de enlace con el esqueleto de triazolopirimidina; especialmente, aquellos, en los que el índice m tiene los valores 1, 2 ó 3.

20 Se prefieren los compuestos I, en los que L_m es fluoro, cloro, metilo, halógeno- alquilo C_1 , metoxi, amino, NHR o NR_2 , donde R es metilo o acetilo.

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



A

25

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

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

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

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

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que L_m representa 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, 10 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-trifluorometil-4-fluoro, 2-trifluorometil-5-fluoro o 2-trifluorometil-5-cloro.

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

Con respecto a su uso son especialmente preferidos los compuestos I resumidos en las Tablas siguientes. Los grupos mencionados en las Tablas para un 20 sustituyente representan, además, por si solos, independientemente de la combinación en que son mencionados, una variante especialmente preferida del respectivo sustituyente.

Tabla 1

25 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-fluoro-6-cloro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 2

30 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-dicloro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea
5 respectivamente de la Tabla A

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-fluoro-6-metilo y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de
10 una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,4,6-trifluoro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea
15 respectivamente de la Tabla A

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxi y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de
20 una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 7

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

Tabla 8

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

Tabla 9

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

5

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-metoxi-6-fluoro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 11

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

15

Tabla 12

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

20

Tabla 13

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

25

Tabla 14

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

30

Tabla 15

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

significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 16

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

Tabla 17

- 10 Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,5-difluoro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 18

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

Tabla 19

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

Tabla 20

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

Tabla 21

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

Tabla 22

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

5

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-dimetilo y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,4,6-trimetilo y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metilo y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 26

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

25

Tabla 27

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-5-fluoro y R^2 significa hidrógeno y la combinación de R^1 , R^3 y R^4 representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

30

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I, en los que X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-5-cloro y R^2

significa hidrógeno y la combinación de R¹, R³ y R⁴ representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla A

No.	R ¹	R ³	R ⁴
A-1	CH ₃	CH=CH ₂	H
A-2	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃
A-3	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	H
A-5	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-6	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₃	CH=CHCH ₃	H
A-8	CH ₃	CH=CHCH ₃	CH ₃
A-9	CH ₃	CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-10	CH ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	H
A-11	CH ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-12	CH ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	H
A-14	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-15	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-16	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-17	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-18	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-19	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-20	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-21	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ²	R ⁴
A-22	CH ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H
A-23	CH ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
A-24	CH ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-25	CH ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	H
A-26	CH ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-27	CH ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-28	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H
A-29	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-30	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-31	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	H
A-32	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-33	CH ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-34	CH ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	H
A-35	CH ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-36	CH ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-37	CH ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	H
A-38	CH ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	CH ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-40	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	H
A-41	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-42	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-43	CH ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-44	CH ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-45	CH ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-46	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H

85
85

No.	R ¹	R ²	R ⁴
A-47	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-48	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-49	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-50	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-51	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-52	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-53	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-54	CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-55	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-56	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-57	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-58	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-59	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-60	CH ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-61	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-62	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-63	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-64	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-65	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-66	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-67	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-68	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-69	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-71	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃

No.	R ¹	R ³	R ⁴
A-72	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-74	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-75	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-76	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-77	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-78	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-80	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-81	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-82	CH ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H
A-83	CH ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃
A-84	CH ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-85	CH ₃	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#	
A-86	CH ₃	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#	
A-87	CH ₃	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#	
A-88	CH ₃	-CH=CHCH ₂ -#	
A-89	CH ₃	-CH=CHCH(CH ₃)-#	
A-90	CF ₃	CH=CH ₂	H
A-91	CF ₃	CH=CH ₂	CH ₃
A-92	CF ₃	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-93	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	H
A-94	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-95	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-96	CF ₃	CH=CHCH ₃	H

87
87

No.	R ¹	R ²	R ³
A-97	CF ₃	CH=CHCH ₃	CH ₃
A-98	CF ₃	CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-99	CF ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	H
A-100	CF ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-101	CF ₃	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-102	CF ₃	CH=C(CH ₃) ₂	H
A-103	CF ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-104	CF ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-105	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-106	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-107	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-108	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-109	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-110	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-111	CF ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H
A-112	CF ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
A-113	CF ₃	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-114	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	H
A-115	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-116	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-117	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H
A-118	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-119	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-120	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	H
A-121	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃

88
88

No.	R ¹	R ²	R ⁴
A-122	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-123	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	H
A-124	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-125	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-126	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	H
A-127	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-128	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-129	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	H
A-130	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-131	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-132	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-133	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-134	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-135	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-136	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-137	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-138	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-139	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-140	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-141	CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-142	CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-143	CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-144	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-145	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-146	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ³	R ⁴
A-147	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-148	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-149	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-150	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-151	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-152	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-153	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-154	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-155	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-156	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-157	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-158	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-159	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-160	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-161	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-162	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-163	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-164	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-165	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-166	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-167	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-168	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-169	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-170	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-171	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H

90
90

No.	R ¹	R ²	R ⁴
A-172	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃
A-173	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-174	CF ₃	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#	
A-175	CF ₃	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#	
A-176	CF ₃	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#	
A-177	CF ₃	-CH=CHCH ₂ -#	
A-178	CF ₃	-CH=CHCH(CH ₃)-#	
A-179	CH ₂ F	CH=CH ₂	H
A-180	CH ₂ F	CH=CH ₂	CH ₃
A-181	CH ₂ F	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-182	CH ₂ F	C(CH ₃)=CH ₂	H
A-183	CH ₂ F	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-184	CH ₂ F	C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-185	CH ₂ F	CH=CHCH ₃	H
A-186	CH ₂ F	CH=CHCH ₃	CH ₃
A-187	CH ₂ F	CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-188	CH ₂ F	CH=CHCH ₂ CH ₃	H
A-189	CH ₂ F	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-190	CH ₂ F	CH=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-191	CH ₂ F	CH=C(CH ₃) ₂	H
A-192	CH ₂ F	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-193	CH ₂ F	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-194	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-195	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-196	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃

91

No.	R ¹	R ³	R ⁴
A-197	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-198	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-199	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-200	CH ₂ F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H
A-201	CH ₂ F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
A-202	CH ₂ F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-203	CH ₂ F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	H
A-204	CH ₂ F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-205	CH ₂ F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-206	CH ₂ F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H
A-207	CH ₂ F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-208	CH ₂ F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-209	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	H
A-210	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₃
A-211	CH ₂ F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-212	CH ₂ F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	H
A-213	CH ₂ F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-214	CH ₂ F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-215	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	H
A-216	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-217	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-218	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	H
A-219	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-220	CH ₂ F	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-221	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	H

No.	R ¹	R ²	R ⁴
A-222	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-223	CH ₂ F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-224	CH ₂ F	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-225	CH ₂ F	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-226	CH ₂ F	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-227	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-228	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-229	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-230	CH ₂ F	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-231	CH ₂ F	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-232	CH ₂ F	CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-233	CH ₂ F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-234	CH ₂ F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-235	CH ₂ F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-236	CH ₂ F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-237	CH ₂ F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-238	CH ₂ F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-239	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	H
A-240	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-241	CH ₂ F	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-242	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-243	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-244	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-245	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-246	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃

No.	R ¹	R ²	R ⁴
A-247	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-248	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-249	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-250	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-251	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H
A-252	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-253	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-254	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H
A-255	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃
A-256	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₂ CH ₃
A-257	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	H
A-258	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-259	CH ₂ F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-260	CH ₂ F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H
A-261	CH ₂ F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃
A-262	CH ₂ F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-263	CH ₂ F	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#	
A-264	CH ₂ F	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#	
A-265	CH ₂ F	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#	
A-266	CH ₂ F	-CH=CHCH ₂ -#	
A-267	CH ₂ F	-CH=CHCH(CH ₃)-#	

representa el enlace con el átomo de nitrógeno

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 *ascomicetos*, *deuteromicetos*, *oomicetos* 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.
- 5
- 10 Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:
- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
 - especies de *Blipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
 - *Blumeria graminis* (oidio) en cereales,
 - 15 • *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,
 - 20 • *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,
 - 25 • *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
 - 30 • especies de *Venturia-Arten* (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.

5

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.

10

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

15

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.

20

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.

25

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.

30

- 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.
- 5
- 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 dibutlnaftalinsulfónico, 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, tributifetil-poliglicol 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,

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

5

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

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

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

Ejemplos de formulaciones son:

25

- 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 ingrediente activo.

30

- II. 30 partes en peso de un compuesto según la invención se mezclan íntimamente 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 superficie del silicagel. De esta forma se obtiene una preparación del ingrediente activo con buena adherencia (contenido en ingrediente activo 23% en peso).

- 5
- 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 ácido 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 ingrediente activo 9% en peso).
- 10
- 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 (contenido en ingrediente activo 16% en peso).
- 15
- 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 diisobutílnaftalín-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).
- 20
- VI. Se mezclan 90 partes en peso de un compuesto según la invención con 10 partes en peso de N-metil-a-pirrolidona y se obtiene una solución apropiada para ser aplicada en forma de gotas minúsculas (contenido en ingrediente activo 90% en peso).
- 25
- 30

- 5 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 activos.
- 10 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 disobutyl-naftalin-a-sulfónico, 17 partes en peso de la sal sódica de una lejía residual sulfúrica 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
- 15 obtiene un caldo de pulverización, que contiene 0,1% en peso del ingrediente activo.

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

25 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

30 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

100

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, Fenprolmorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
 - anilinoimidinas, tales como Pyrimethanil, Mepanipyrim o Cyrodinyl,

101

- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomina,
- azoles, tales como Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinltroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol,
- 5 Flutriafol, Hexaconazol, Imazalilo, Metconazol, Myclobutanyl, Penconazol, Propiconazol, Procloroaz, Protioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- dicarboximidas, tales como Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- ditiocarbamatos, tales como Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam,
- 10 Metram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como Anilazin, Benomilo, Boscalid, Carbendazim, carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanilo, Furametpir, Isoprotilan, Mepronilo, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, pirifenox,
- 15 Pyroquilon, Quinoxifen, Siltiofam, Thlabendazol, Thifluzamid, tiofanato-metilo, Tiadinyl, 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-Isopropilo,
- 20 fenilpirroles, tales como Fenpiclonyl o Fludioxonyl,
- azufre,
- otros fungicidas, tales como Acibencenoar-S-metilo, Benthiallcarb, Carpropamid, clorothalonilo, Cyflufenamid, Cymoxanilo, Dazomet, dclomezin, dclocymet, dietofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-acetato,
- 25 Fenoxanyl, Ferimzone, Fluazinam, Fosethyl, Fosethyl-aluminio, Iprovalicarb, hexaclorobenceno, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, ftalida, Toloclofos-metilo, Quintozene, Zoxamid,
- estrobilorinas, tales como Azoxistrobin, Dimoxistrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-metilo, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxistrobin, Pyraclostrobin o
- 30 Trifloxistrobin,

- derivados de ácido sulfénico, tales como Captafol, Captan, Dichlofuanid, 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

10 Tablas con sus datos físicos.

Ejemplo 1 – Obtención de 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(1-metil-2-propen-1-il)-amino[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 98/46607] en 20 ml de diclorometano se mezcló bajo agitación con una solución de 1,5 mmol de (1-metil-2-propen-1-il)amina [ver US 4 120 901; J. Chem. Soc., Chem. Commun., p. 794 (1984)] y 1,5 mmol de

20 trietilamina en 10 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó aproximadamente 16 horas a 20 – 25°C y luego se lavó con solución diluida de HCl. Después de la separación de fases se secó la fase orgánica y se libró del disolvente. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 0,52 g del compuesto indicado en el título con un p.f. de 101 °C.

25

Ejemplo 2 - Obtención de 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(2,5-dimetilpirrod-3-en-1-il)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

Una mezcla de 0,1 mol del compuesto I-10 y 0,25 mol de cianuro de tetraetilamonio en 750 ml de dimetilformamida (DMF) se agitó aproximadamente 16 horas a 20-25°C. Después de haber adicionado agua y éter metil-terc.butilico (MTBE) y haber

30 separado las fases se lavó la fase orgánica con agua, luego se secó y se libró del

disolvente. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 4,32 g del compuesto indicado en el título del punto de fusión de 206 °C.

5 Ejemplo 3 - Obtención de 5-metoxi-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(2,5-dimetilpirrod-3-en-1-il)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

Una solución de 65 mmol del compuesto I-10 en 400 ml de metanol anhidro se mezcló con 71,5 mmol de solución de metanolato sódico (al 30%) a 20-25°C. Después de haber agitado aprox. 16 horas a esta temperatura, se destiló el
10 disolvente y se absorbió el residuo en diclorometano. La fase orgánica se lavó con agua, se secó y luego se libró del disolvente. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel se obtuvieron 4,05 g del compuesto indicado en el título del punto de fusión de 149 °C.

15 Ejemplo 4 - Obtención de 5-metil-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(2,5-dimetilpirrod-3-en-1-il)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

Una mezcla de 20 ml malonato de dietilo y 0,27 g (5,65 mmol) de hidruro sódico (dispersión al 50% en aceite mineral) en 50 ml de acetonitrilo se agitó durante
20 aproximadamente dos horas a 20-25°C. Luego se adicionó 4,7 mmol del compuesto I-10 y se agitó la mezcla durante aproximadamente 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 se extrajo la mezcla con MTBE. Las fases orgánicas reunidas fueron libradas del disolvente después del secado. El producto crudo
25 purificado por cromatografía en silicagel fue absorbido en HCl. concentrado y la mezcla fue agitada, luego durante aprox. 24 horas a 80°C. Después del enfriamiento se reguló con solución acuosa de NaOH un valor pH de 5 y se extrajo la mezcla de reacción con MTBE. Las fases orgánicas reunidas fueron libradas del disolvente después del secado. Purificando el residuo por cromatografía en silicagel
30 se obtuvieron 0,62 g del compuesto indicado en el título.

¹H-NMR (δ in ppm): 8,42 (s); 6,85 (m); 5,75 (s); 4,75 (q); 2,42 (s); 1,10 (s).

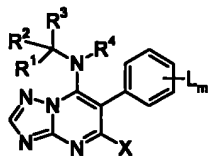


Tabla I

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	L _m	Datos físicos (p.f. [°C])
I-1	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	101
I-2	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	154
I-3	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2,4,6-F ₃	88
I-4	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	143
I-5	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2,4,6-F ₃	127
I-6	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	115
I-7	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	105
I-8	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-Cl-6-F	131
I-9	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2,6-F ₂	143
I-10	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2,4,6-F ₃	105
I-11	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2,4-F ₂	118
I-12	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2,4-F ₂	111
I-13	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-Cl	151
I-14	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-F	149
I-15	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	96
I-16	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	121
I-17	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	85

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	L _m	Datos físicos (p.f. [°C])
I-18	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	105
I-19	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	126
I-20	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2,4-F ₂	72
I-21	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2,4-F ₂	92
I-22	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2,4-F ₂	72
I-23	CH ₃	H	CH=CH ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	80
I-24	CH ₃	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	72
I-25	CH ₃	H	CH=CHCH ₃	H	Cl	2-Cl-4-F	98
I-26	CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	132
I-27	CH ₃	H	CH=CH ₂	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	158
I-28	CH ₃	H	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	91
I-29	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2,4,6-F ₃	118
I-30	CH ₃	H	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -#		Cl	2,4,6-F ₃	151
I-31	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	107
I-32	CH ₃	H	-CH=CHC(CH ₃) ₂ -#		Cl	2-CH ₃ -4-F	183
I-33	CH ₃	H	C(CH ₃)=CHCH ₃	H	Cl	2-CH ₃ -4-F	118
I-34	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2,4-F ₂	90
I-35	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	Cl	2-Cl-4-F	98

caracteriza el enlace con el átomo de nitrógeno

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

Ejemplos de la acción contra hongos nocivos

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

5

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

10

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

15 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 Ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente, se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani* en 2 % de solución de biomaltita con una densidad de $0,17 \times 10^8$ de esporas/ml. A continuación, se colocaron las
20 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 visualmente en %.

25 En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los Ingredientes activos Nos. I-1, I-5 y I-7 no presentaron ninguna infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en un 100%.

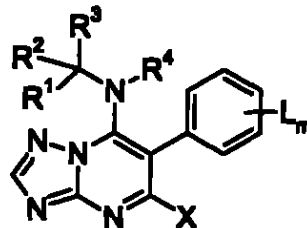
30 Ejemplo de aplicación 2 - Eficiencia contra el moho gris en hojas de pimiento causado por *Botrytis cinerea*

107
107

- Plántulas de pimienta de la variedad "Neusiedler Ideal Elite" fueron pulverizadas hasta chorrear, después de que se habían desarrollado bien 4 a 5 hojas, con una suspensión acuosa con la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente, se inocularon las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea*, que contenía $1,7 \times 10^8$ esporas/ml en una solución acuosa al 2% de biomalta.
- 5 A continuación, se colocaron las plantas de ensayo en una cámara climática con 22 a 24°C y alta humedad del aire. Después de 5 días se podía determinar visualmente la extensión de la infestación por el hongo en %.
- 10 En este test, las plantas tratadas con 250 ppm de los ingredientes activos presentaban una infección de hasta un 3%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 80%.

Reivindicaciones

1. 7-Alquenilamino-triazolopirimidinas de la fórmula I



5 en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

L significan, independientemente, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-halógenoalquilo, C₁-C₆-alcoxi, amino, NHR o NR₂,

10 R es alquilo C₁-C₆ o alquilcarbonilo C₁-C₆;

m es 1, 2, 3, 4 ó 5;

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

15

R¹ es alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃;

R² es hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃;

20

R³ es alquenilo C₂-C₁₀, que puede ser no sustituido o parcial o completamente sustituido o llevar uno a tres grupos R^a:

R^a es halógeno, ciano, nitró, hidróxi, -alquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, -alquilto C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, di -alquilamino C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquiloxi C₃-C₆ o -cicloalquilo C₃-C₆,

25

for
109

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

5 R^b es halógeno, ciano, nítro, hidroxí, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxido, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquillaminocarbonilo, dialquillaminocarbonilo, alquillaminotio-

10 carbonilo, dialquillaminotiocarbonilo, 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;

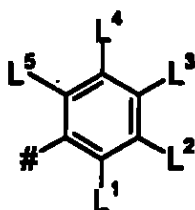
15 R^4 es hidrógeno o alquilo C_1-C_2 .

R^3 y R^4 también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo no saturados de cinco o seis miembros, que puede llevar uno o varios sustituyentes R^a .

20

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde X es cloro o metilo, especialmente, cloro.
3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R^1 es metilo o halógenometilo.
- 25 4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde R^2 es hidrógeno.
- 30 5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa el grupo A

110



A

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

L¹ es flúor, cloro, CH₃ o CF₃;

5

L², L⁴ significan, independientemente, hidrógeno o flúor;

L³ es hidrógeno, flúor, cloro, CH₃, OCH₃, amino, NHR o NR₂; y

10

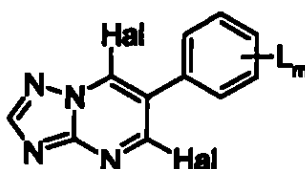
L⁵ es hidrógeno, flúor o CH₃.

6. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4, 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-metoxietoxi-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.

15

20

7. Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, haciendo reaccionar dihalógenotriazolopyrildinas de la fórmula II,



II

25

///

donde las variables tienen los significados indicados para la fórmula I y Hal es un átomo de halógeno, especialmente, cloro, con aminas de la fórmula III.



- 5 8. Producto apropiado para combatir hongos nocivos, que contienen un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.
9. 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.
- 10

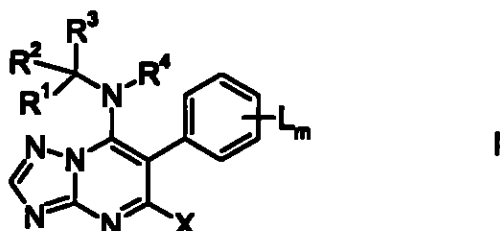
1/2

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

Resumen

5

7-Alquenilamino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10 L es halógeno, alquilo, halógenoalquilo, alcoxi, amino, NHR o NR₂; R alquilo o alquilcarbonilo; m 1, 2, 3, 4 o 5;

X es halógeno, ciano, alquilo, halógenoalquilo o alcoxi;

15 R¹ es alquilo o halógenoalquilo;

R² es hidrógeno, alquilo o halógenoalquilo;

20 R³ alquenilo que puede ser no sustituido o parcialmente o completamente halogenado o estar sustituido en la forma descrita en la memoria descriptiva;

R⁴ es hidrógeno o alquilo,

25 R³ y R⁴ también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo no saturados de cinco o seis miembros, que puede llevar uno o varios sustituyentes Rⁿ.

113

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/003102

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	WO 02/02563 A (AMERICAN HOME PROD) 10 January 2002 (2002-01-10) abstract; example 52	1-6
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7 July 1993 (1993-07-07) Zeilen 45 und 47 in der Tabelle I abstract; claim 1	1-9
Y	US 6 284 762 B1 (PFRENGLE WALDEMAR) 4 September 2001 (2001-09-04) abstract; claim 1; examples 15,20,29,42	1-9
	-/-	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

20 July 2004

Date of mailing of the international search report

29/07/2004

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 31 851 epo nl
Fax (+31-70) 340-8018

Authorized officer

Guspanova, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/003102

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 02/083676 A (BASF AG ; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMAN EBERHARD) 24 October 2002 (2002-10-24) Zeilen A-9 bis A-16 und A-33 bis A-40 in der Tabelle A Zeilen I-2 und I-10 bis I-15 in der Tabelle I abstract; claim 1	1-9
Y	WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16 January 2003 (2003-01-16) abstract; claim 1; table A	1-9
P	WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2 October 2003 (2003-10-02) page 5, lines 6-28; claims 1,6; tables 1-19 Zeilen A-77 bis A-79 in der Tabelle A abstract	1-9

1.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/003102

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0202563	A	10-01-2002	AU 7306201 A	14-01-2002
			BG 107277 A	30-01-2004
			BR 0112038 A	01-04-2003
			CA 2413802 A1	10-01-2002
			CZ 20024150 A3	17-09-2003
			EP 1307200 A2	07-05-2003
			HU 0300798 A2	28-07-2003
			JP 2004502691 T	29-01-2004
			NO 20026195 A	27-02-2003
			SK 18412002 A3	03-06-2003
			WO 0202563 A2	10-01-2002
			US 2002068744 A1	06-06-2002
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
US 6284762	B1	04-09-2001	AT 239727 T	15-05-2003
			AT 228133 T	15-12-2002
			AU 752669 B2	26-09-2002
			AU 3098599 A	18-10-1999
			AU 735730 B2	12-07-2001
			AU 6867198 A	11-11-1998
			BG 64197 B1	30-04-2004
			BG 103805 A	30-06-2000
			BR 9808531 A	23-05-2000
			BR 9909009 A	28-11-2000
			CA 2287470 A1	22-10-1998

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/003102

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date	
US 6284762	B1	CA 2324154 A1	30-09-1999	
		CN 1302299 T	04-07-2001	
		CZ 20003472 A3	16-01-2002	
		CZ 292092 B6	16-07-2003	
		DE 69814375 D1	12-06-2003	
		DE 69814375 T2	24-12-2003	
		DE 69903988 D1	02-01-2003	
		DE 69903988 T2	27-03-2003	
		DK 975635 T3	02-06-2003	
		DK 945453 T3	16-12-2002	
		EA 2906 B1	31-10-2002	
		EA 3281 B1	24-04-2003	
		EE 9900486 A	15-06-2000	
		EP 0975635 A1	02-02-2000	
		EP 0945453 A1	29-09-1999	
		EP 1066291 A1	10-01-2001	
		ES 2188094 T3	16-06-2003	
		HU 0001993 A2	28-10-2000	
		HU 0101751 A2	28-10-2001	
		IL 132238 A	29-05-2003	
		JP 11322750 A	24-11-1999	
		JP 2001520650 T	30-10-2001	
		JP 2003522100 T	22-07-2003	
		NO 994973 A	13-10-1999	
		NZ 500143 A	29-06-2001	
		PL 343176 A1	30-07-2001	
		PT 945453 T	31-03-2003	
		SI 975635 T1	31-10-2003	
		SK 141499 A3	11-09-2001	
		WO 9948893 A1	30-09-1999	
		ZA 200005867 A	22-10-2001	
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
WO 03004465	A	16-01-2003	BR 0210858 A	29-06-2004
			CA 2452625 A1	16-01-2003
			WO 03004465 A2	16-01-2003
			EP 1406903 A2	14-04-2004
WO 03080615	A	02-10-2003	WO 03080615 A1	02-10-2003

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Abkürzungszeichen
PCT/EP2004/003102

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGS/GEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (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	WO 02/02563 A (AMERICAN HOME PROD) 10. Januar 2002 (2002-01-10) Zusammenfassung; Beispiel 52	1-6
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07) Zeilen 45 und 47 in der Tabelle I Zusammenfassung; Anspruch 1	1-9
Y	US 6 284 762 B1 (PFRENGLE WALDEMAR) 4. September 2001 (2001-09-04) Zusammenfassung; Anspruch 1; Beispiele 15,20,29,42	1-9
	— — — — — -/-	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

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

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

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

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

20. Juli 2004

Abschlußdatum des internationalen Recherchenberichts

29/07/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5518 Patentien 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Guspanova, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Abkommen
PCT/EP2004/003102

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 02/083676 A (BASF AG ; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMAN EBERHARD) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) Zeilen A-9 bis A-16 und A-33 bis A-40 in der Tabelle A Zeilen I-2 und I-10 bis I-15 in der Tabelle I Zusammenfassung; Anspruch 1	1-9
Y	WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16. Januar 2003 (2003-01-16) Zusammenfassung; Anspruch 1; Tabelle A	1-9
P	WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) Seite 5, Zeilen 6-28; Ansprüche 1,6; Tabellen 1-19 Zeilen A-77 bis A-79 in der Tabelle A Zusammenfassung	1-9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abkürzungszeichen

PCT/EP2004/003102

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0202563 A	10-01-2002	AU 7306201 A	14-01-2002
		BG 107277 A	30-01-2004
		BR 0112038 A	01-04-2003
		CA 2413802 A1	10-01-2002
		CZ 20024150 A3	17-09-2003
		EP 1307200 A2	07-05-2003
		HU 0300798 A2	28-07-2003
		JP 2004502691 T	29-01-2004
		NO 20026195 A	27-02-2003
		SK 18412002 A3	03-06-2003
		WO 0202563 A2	10-01-2002
		US 2002068744 A1	06-06-2002
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
US 6284762 B1	04-09-2001	AT 239727 T	15-05-2003
		AT 228133 T	15-12-2002
		AU 752669 B2	26-09-2002
		AU 3098599 A	18-10-1999
		AU 735730 B2	12-07-2001
		AU 6867198 A	11-11-1998
		BG 64197 B1	30-04-2004
		BG 103805 A	30-06-2000
		BR 9808531 A	23-05-2000
		BR 9909009 A	28-11-2000
		CA 2287470 A1	22-10-1998

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abkürzungen

PCT/EP2004/003102

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung				
US 6284762	B1	CA	2324154 A1	30-09-1999			
		CN	1302299 T	04-07-2001			
		CZ	20003472 A3	16-01-2002			
		CZ	292092 B6	16-07-2003			
		DE	69814375 D1	12-06-2003			
		DE	69814375 T2	24-12-2003			
		DE	69903988 D1	02-01-2003			
		DE	69903988 T2	27-03-2003			
		DK	975635 T3	02-06-2003			
		DK	945453 T3	16-12-2002			
		EA	2906 B1	31-10-2002			
		EA	3281 B1	24-04-2003			
		EE	9900486 A	15-06-2000			
		EP	0975635 A1	02-02-2000			
		EP	0945453 A1	29-09-1999			
		EP	1066291 A1	10-01-2001			
		ES	2188094 T3	16-06-2003			
		HU	0001993 A2	28-10-2000			
		HU	0101751 A2	28-10-2001			
		IL	132238 A	29-05-2003			
		JP	11322750 A	24-11-1999			
		JP	2001520650 T	30-10-2001			
		JP	2003522100 T	22-07-2003			
		NO	994973 A	13-10-1999			
		NZ	500143 A	29-06-2001			
		PL	343176 A1	30-07-2001			
		PT	945453 T	31-03-2003			
		SI	975635 T1	31-10-2003			
		SK	141499 A3	11-09-2001			
		WO	9948893 A1	30-09-1999			
		ZA	200005867 A	22-10-2001			
		WO 02083676	A	24-10-2002	BR	0208756 A	11-05-2004
					CA	2443596 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		
WO 03004465	A	16-01-2003	BR	0210858 A	29-06-2004		
			CA	2452625 A1	16-01-2003		
			WO	03004465 A2	16-01-2003		
			EP	1406903 A2	14-04-2004		
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

Patente, Marken u. Lizenzen

23 März 2005

PCT

An:

BASF AKTIENGESELLSCHAFT
67065 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG
DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN
BERICHTS ZUR PATENTIERBARKEIT

(Regel 71.1 PCT)

Absendedatum
(Tag/Monat/Jahr)

22.03.2005

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
0000054413

WICHTIGE MITTEILUNG

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/003102

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)

24.03.2004

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)

31.03.2003

Anmelder

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

9. NP 30.09.05

1. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiernit 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 - 4485

Bevollmächtigter Bediensteter

Hebert, W

Tel. +49 89 2399-2152



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

119

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054413	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA18	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/003102	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 24.03.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 31.03.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487D4, A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
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 7 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/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerisierbarer 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 03.09.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 22.03.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Guspanova, J Tel. +49 89 2399-7834 	

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003102

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

1-33

In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10

eingegangen am 03.08.2004 mit Schreiben vom 27.08.2004

☐ 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.

121

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003102

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 1-10 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche |
| | Nein: Ansprüche 1-10 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-10 |
| | 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

Zu Punkt V

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

1. Relevante Dokumente

In diesem Bescheid werden folgende, im Recherchenbericht zitierte Dokumente D1- D5 genannt; die Numerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

- D1: WO 02/02563 A (AMERICAN HOME PROD) 10. Januar 2002 (2002-01-10)
D2: EP-A-0 550 113 (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07)
D3: US-B-6 284 7621 (PFRENGLE WALDEMAR) 4. September 2001 (2001-09-04)
D4: WO 02/083676 A (BASF AG ; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE);
AMMERMANN EBERHARD) 24. Oktober 2002 (2002-10-24)
D5: WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE);
BASF AG (DE); GEWEHR M) 16. Januar 2003 (2003-01-16)

2. Änderungen

Alle eingereichten Änderungen bringen keine Sachverhalte ein, die im Widerspruch zu Artikel 19(2) PCT über den Offenbarungsgehalt der Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgehen würden.

3. Neuheit

Die vorliegende Anmeldung betrifft 7-alkenylamino-Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I (Ansprüche 2-8), ein Verfahren zu ihrer Herstellung (Anspruch 9) und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen (Ansprüche 1 und 10).

Das Dokument D1 offenbart eine sehr breite Familie von Triazolopyrimidine-Verbindungen, die sich als Antikrebsmittel eignen. Die Verbindung des Beispiels 52 fällt nicht mehr unter die Ansprüche 2-8 der vorliegenden Anmeldung, weil der Gegenstand der neuen Verbindungsansprüchen 2-8 gegen D1 abgegrenzt wurde. Der Gegenstand dieser

123

Ansprüche ist somit gegenüber D1 neu, gemäß Artikel 33(2) PCT. D1 offenbart sowohl kein Verfahren zur Herstellung von Verbindung des Beispiels 52 als auch keine fungizide Aktivität. Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1, 9 und 10 ist somit auch als neu angesehen.

Die Dokumente D2-D4 offenbaren i.a. 7-alkenylamino-Triazolopyrimidine, die jeweils durch eine allgemeine Formel definiert sind. Alle diese Verbindungen werden zur Bekämpfung von Schadpilzen verwendet. Folgende Verbindungen sind explicit offenbart:

D2: Zeilen 45 und 47 in der Tabelle I;

D3: Beispiele 15, 20, 29 und 42;

D4: Zeilen I-2 und I-10 bis I-15.

Der einzige Unterschied zwischen den offenbarten Verbindungen aus dem Stand der Technik D2-D4 und den vorliegenden Verbindungen liegt im Charakter des Kohlenstoffatoms der Alkenylgruppe, das an das Stickstoffatom (7-Aminogruppe) angebunden ist. Dieses Kohlenstoffatom trägt im D2-D4 jeweils 2 Wasserstoffatome, wobei in der vorliegenden Anmeldung dieses bloss einen oder keinen Wasserstoffatom trägt. In anderen Worten 7-Aminogruppe ist durch andere Alkenyl-Isomere substituiert. Der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber dem Stand der Technik D2-D4 neu.

Das Dokument D5 offenbart Triazolopyrimidine der allgemeiner Formel (I), die sich von der vorliegenden Formel dadurch unterscheidet, das sie keine Aminogruppe in der Stellung 7 trägt, sondern lediglich Kohlenwasserstoffresten (siehe Definition für den Substituenten R¹). Die Verbindungen von D5 werden zur Bekämpfung von Schadpilzen verwendet.

Der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber dem Stand der Technik D1-D5 neu, gemäss Artikel 33(2) PCT.

4. Erfinderische Tätigkeit

Das Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen anstatt der Verbindungen der Formel I wurde mit den eingereichten Änderungen zum Hauptanspruch gemacht. Der unabhängige Anspruch für die Verbindungen der Formel I wurde jedoch in einer eingeschränkter Form als der Anspruch 2 aufrechterhalten. Somit wird die der Erfindung zugrundeliegende

124
124

Aufgabe nicht neu formuliert.

Die der Erfindung zugrundeliegende Aufgabe war es, weitere Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Jedes der Dokumente D2-D4 kann als nächstliegender Stand der Technik angesehen werden. Diese Dokumente offenbaren Verbindungen, die sich von den vorliegenden Verbindungen strukturell nur gering unterscheiden, wie bereits unter Neuheit besprochen wurde.

Die Lösung der obengenannten Aufgabe beruht in der Herstellung von Verbindungen, die durch allgemeine Formel (I) im Anspruch 1 definiert sind. Die Daten für die Aktivität der ausgewählten Verbindungen sind auf der Seite 33, Zeilen 24-25 und 39-40 gegeben.

Die in Anspruch 2 der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagene Lösung kann aus folgenden Gründen nicht als erfinderisch betrachtet werden (Artikel 33(3) PCT): Ausgegangen von D2-D4-Verbindungen, der Fachmann hätte die 7-Amino-Gruppe lediglich durch andere Alkenyl-Isomere substituieren müssen, um zu den vorliegenden Verbindungen zu gelangen. Zum Beispiel anstatt $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ Gruppe eine $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ Gruppe. In anderen Worten, der Fachmann müsste noch eine weitere Alkyl-Gruppe an das Kohlenstoffatom, das mit dem 7-Stickstoffatom benachbart ist, einführen. D2-D4 schlägt eine solche Modifizierung nicht vor, jedoch ist diese für den Fachmann als eine übliche Vorgehensweise angesehen. Der Fachmann würde versuchen weitere Alkenyl-Isomere an die 7-Amino-Gruppe einzuführen, wobei er die gleiche oder ähnliche Wirkung bei solchen neuen Derivaten erwarten würde. Weiterhin eine breite Auswahl an Alkenyl-Isomere in der Stellung 7 des Triazolopyrimidingerüsts sind im Dokument D5 offenbart (Tabelle A: z.B. A-146, A-160, A-164...). Angesichts der Ausführungen in der Tabelle A in D5 würde es der Fachmann als übliche Vorgehensweise ansehen, die Alkenyl-Substituenten aus dem Dokument D5 und die substituierte Amino-Gruppe in den Verbindungen aus D2-D4 miteinander zu kombinieren. Der Fachmann würde wahrscheinlich bei einer solchen geringfügigen Modifikation keine erhebliche Wirkungsänderung erwarten. Die vorliegenden Verbindungen mit einer erhöhten Aktivität wären als nicht naheliegend angesehen. Jedoch die Anmeldungsunterlagen enthalten keine ausreichenden Angaben, aufgrund deren glaubhaft sein könnte, dass die

125

vorliegenden Verbindungen eine überraschende/bessere Wirkung gegenüber den Verbindungen aus dem Stand der Technik D2-D4 aufweisen. Das Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen per se wird ebenfalls als nicht erfinderisch angesehen, weil dieses keine weiteren technischen Merkmale enthält als bloss eine Behandlung von Schadpilzen mit einer Verbindung der Formel I, die als nicht erfinderisch betrachtet wird. Den obengenannten Mängeln wegen kann eine erfinderische Tätigkeit nicht anerkannt werden, gemäss Artikel 33(3) PCT.

Zu Punkt VI

Bestimmte angeführte Unterlagen

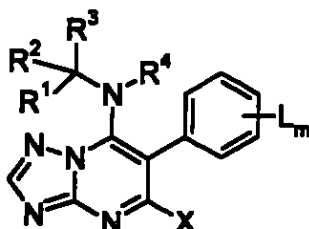
Bestimmte veröffentlichte Unterlagen

Anmelde Nr. Patent Nr.	Veröffentlichungsdatum (Tag/Monat/Jahr)	Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (zu Recht beansprucht) (Tag/Monat/Jahr)
WO 03/080615	02.10.2003	19.03.2003	21.03.2002

126

We claim:-

1. A method for the control of harmful phytopathogenic fungi, which comprises treating the fungi or the materials, plants, ground or seeds to be protected from fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I



in which the substituents have the following meanings:

- L is, independently of one another, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, amino, NHR or NR₂,
- R is C₁-C₆-alkyl or C₁-C₆-alkylcarbonyl;
- m is 1, 2, 3, 4 or 5;
- X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl or C₁-C₄-alkoxy;
- R¹ is C₁-C₃-alkyl or C₁-C₃-haloalkyl;
- R² is hydrogen, C₁-C₃-alkyl or C₁-C₃-haloalkyl;
- R³ is C₂-C₁₀-alkenyl, which can be unsubstituted or partially or completely halogenated or can carry one to three R^a groups:
- R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy or C₃-C₆-cycloalkyl,
- these aliphatic or alicyclic groups for their part being able to be partially or completely halogenated or to carry one to three R^b groups:
- R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy,

AMENDED SHEET

127
127

5

alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, di-alkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl or dialkylaminothiocarbonyl, the alkyl groups in these radicals comprising 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals comprising 2 to 8 carbon atoms;

R^4 is hydrogen or C_1 - C_2 -alkyl,

10

R^3 and R^4 can also, together with the nitrogen atom to which they are bonded, form a five- or six-membered unsaturated ring which can carry one or more R^a substituents.

15

2. The 7-(alkenylamino)triazolopyrimidine of the formula I according to claim 1, with the exclusion of compounds in which the ring formed by R^3 and R^4 together is a dihydropyrrole.

20

3. The compound of the formula I according to claim 1, in which R^3 is C_2 - C_{10} -alkenyl, which can be unsubstituted or partially or completely halogenated or can carry one to three R^a groups:

25

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -haloalkoxy, C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_8 -alkylthio, C_1 - C_8 -alkylamino, di(C_1 - C_8 -alkyl)amino, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkenyloxy, C_3 - C_8 -alkynyloxy or C_3 - C_8 -cycloalkyl,

30

R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, di-alkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl or dialkylaminothiocarbonyl, the alkyl groups in these radicals comprising 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals comprising 2 to 8 carbon atoms;

35

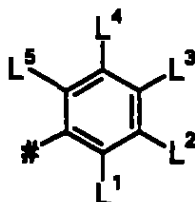
40

R^4 is hydrogen or C_1 - C_2 -alkyl.

AMENDED SHEET

128
128

4. The compound of the formula I according to either of claims 2 and 3, wherein X represents chlorine or methyl, in particular chlorine.
5. The compound of the formula I according to any of claims 2 to 4, wherein R¹ represents methyl or halomethyl.
6. The compound of the formula I according to any of claims 2 to 5, wherein R² represents hydrogen.
7. The compound of the formula I according to any of claims 2 to 6, wherein the phenyl group substituted by L_m is the group A



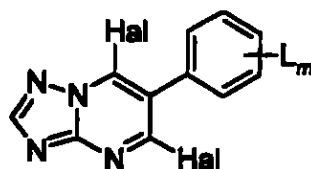
A

in which # is the point of linkage with the triazolopyrimidine skeleton and

- L¹ represents fluorine, chlorine, CH₃ or CF₃;
- L² and L⁴ represent, independently of one another, hydrogen or fluorine;
- L³ represents hydrogen, fluorine, chlorine, CH₃, OCH₃, amino, NHR or NR₂; and
- L⁵ represents hydrogen, fluorine or CH₃.
8. The compound of the formula I according to any of claims 2 to 7; wherein the phenyl group substituted by L_m is one of the following substituent combinations: 2-fluoro-6-chloro, 2,6-difluoro, 2,6-dichloro, 2-fluoro-6-methyl, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-methoxy, pentafluoro, 2-methyl-4-fluoro, 2-trifluoromethyl, 2-methoxy-6-fluoro, 2-chloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-chloro, 2-chloro-4-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-methyl, 2,4-dimethyl, 2-methyl-4-chloro, 2-fluoro-4-methyl, 2,6-dimethyl, 2,4,6-trimethyl, 2,6-difluoro-4-methyl, 2-trifluoromethyl-4-fluoro, 2-trifluoromethyl-5-fluoro or 2-trifluoromethyl-5-chloro.
9. A process for the preparation of the compound of the formula I according to claim 2 by reaction of dihalotriazolopyrimidines of the formula II,

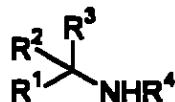
AMENDED SHEET

37



II

in which the variables have the meanings given for formula I and Hal is a halogen atom, in particular chlorine, with amines of the formula III.



III

5

10. A composition suitable for the control of harmful fungi, comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to claim 1.

AMENDED SHEET



F RMATO DE DIGITALIZACI N
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Desarrollo de Software y Servicios

Expediente No		05110738	No de Follo
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	1	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:

Sobre Con Aote Final

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 81.651
FECHA : OCTUBRE 24 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	31556195	24/10/2005	38,640,040.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-06	REGISTRO DE CESION, CAMBIO NOM	
13		NOMBRES Y ENSENAS COMERCIALES, MAR	224,000.00
		TOTAL :	224,000.00

SON: DOSCIENTOS VEINTICUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Go 00361-841-059-5

133

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Adicacion : 05110738 00000000 Folios: 133
Fecha (IMP): 2005-10-31 17:01:01
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE MAR: 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS OPERACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 81,652
FECHA : OCTUBRE 24 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	31556195	24/10/2005	38,640,040.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-06	REGISTRO DE CESION, CAMBIO NOM	
		13 NOMBRES Y ENSENAS COMERCIALES, MAR	224,000.00
		TOTAL :	\$ 224,000.00

SOM: DOSCIENTOS VEINTICUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

060 00361-841-059-5

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL
TRAMITE

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

Firma Responsable:



Fecha:

2020
Bogotá DC

Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA:	Radicación No.	05-110738
	Solicitud Internacional	PCT/EP2004/003102
	Fecha inicio fase nacional	31-10-2005
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	884
	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

8 6 DIC. 2005


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

202030

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-110738

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

PCT FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 563

DE FECHA 28 DE ABRIL DEL 2006, EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL 31 DE JULIO DEL 2006

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

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI __ __

NO__ X__ __

Bogotá D.C., Febrero de 2007