

281



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

05-116329

21 EXPEDIENTE No.

54 TITULO

PIRIMIDINAS-2-SUBSTITUIDAS

51 CLASIFICACION INTERNACIONAL

ADIN 43/54 COTD 239/48

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

INDUSTRIA Y COMERCIO

Fecha REC 2005 10 19-20 10

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE

PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 ☒ Patente de Invención ☐ Patente de Modelo de Utilidad ☐ Capítulo I ☒ Capítulo II		
2 SOLICITANTE (71)	Nombre BASF AKTIENGESSELLSCHAFT sociedad constituida y existente bajo las leyes de República Federal de Alemania Dirección 87056 Ludwigshafen República Federal de Alemania Domicilio Ludwigshafen República Federal de Alemania	IDENTIFICACIÓN CC ☐ NIT ☐ CE ☐ Otro ☐ Cual Numero
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre EMILIO FERRERO Dirección Carrera 4ª No 72-35 Teléfono 347 38 11 Fax 211 86 50 E-mail clientes@camyp.com. Domicilio Bogotá, Colombia	IDENTIFICACIÓN CC ☒ NIT ☐ CE ☐ Otro ☐ Cual Numero 438 019 T P 31 929
4 INVENTOR (ES) (72)	1 Jordi TORMO I BLASCO Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudendach, República Federal de Alemania 2 Carsten BLETNER Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim, República Federal de Alemania 3 Bernd MÜLLER Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal, República Federal de Alemania 4 Markus GEWEHR Goethestr 21 56288 Kastellaun, República Federal de Alemania 5 Wassilios GRAMMENOS Alexander-Fleming-Str 13 67071 Ludwigshafen, República Federal de Alemania 6 Thomas GROTE Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim República Federal de Alemania 7 Andreas GYPSE B4 4, 68159 Mannheim República Federal de Alemania 9 Peter SCHÄFER Römerstr 1, 67308 Ottersheim República Federal de Alemania 10 Frank SCHIEWECK Lindenweg 4, 67258 Hessheim, República Federal de Alemania 11 Anja SCHWÖGLER Heinrich-Lanz-Str 3 68165 Mannheim República Federal de Alemania 12 Oliver WAGNER Im Meisental 50, 67433 Neustadt República federal de Alemania 13 Siegfried STRATHMANN Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof República Federal de Alemania 14 Ulrich SCHÖFL Luftschiffring 22c, 68782 Brühl República Federal de Alemania 15 Maria SCHERER Hermann-Jürgens-Strasse 30, 76829 Godramstein República Federal de Alemania	

	8 Joachim RHEINHEIMER Merzger Str 24 67063 Ludwigshafen República Federal de Alemania	16 Reinhard STIERL Jahnstr 8, 67251 Freinsheim República Federal de Alemania
--	---	--

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No PCT/EP2004/004957

Publicación Internacional No WO 2004/103978 A1

Fecha

10 de mayo de 2004

Fecha

2 de diciembre de 2004

6

TÍTULO (54) PIRIMIDINAS 2- SUBSTITUIDAS

7

Clasificación Internacional (51) C07D 239/48

A 01 N 43/44
C 07 P 239/48

8 Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Numero de Solicitud
SI ☒ NO ☐	<u>DE</u>	<u>20/05/2003</u>	<u>103 23 026 2</u>

9

Comprobante de pago No

Fecha

10

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 443 000 oo

☐

Comprobante de pago por reivindicación de prioridad

☒

Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica

☒

Poderes, si fuere el caso

☒

Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante

☐

Declaraciones

☒

Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)

☒

Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)

☒

Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA

☐

Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA

☐

De ser el caso, copia del contrato de acceso

☐

De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas

☐

De ser el caso, certificado de depósito del material biológico

☒

Arte final 12x12

☐

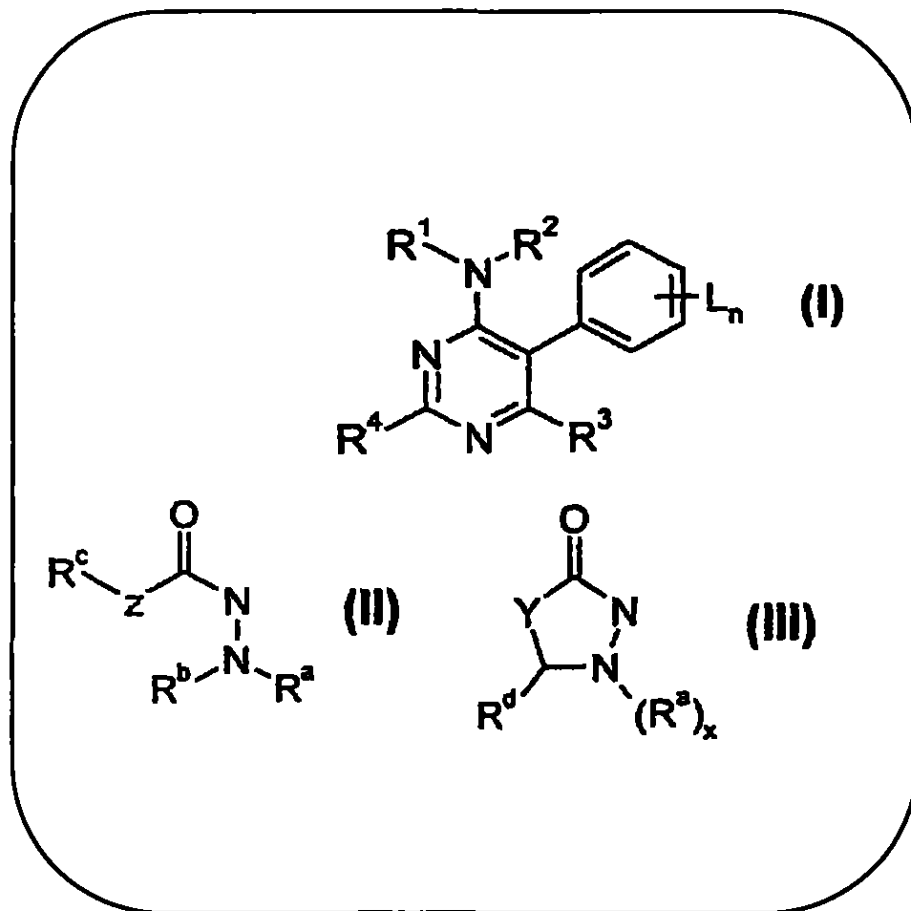
De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud

☒

Otros VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE

EMILIO FERRERO

FIRMA

C C 438 019 de Usaquén T P 31 929

ZCA

**DOCUMENTOS ANEXOS****1 ☒ Publicación Internacional WO 2004/103978 A1**

Descripción

Páginas 53 en el idioma originalPáginas 78 en españolReivindicaciones Número (s) 12

Figuras Número (s)

2 ☒ Forma PCT/ISA/210 Informe de Búsqueda Internacional**3 ☒ Extracto de publicación****NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

REPRESENTACION Y PODER

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Yo (nosotros) abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República
Federal de Alemania

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831, ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519, y EMILIO FERRERO, tpa. 31929, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 843 del Código de Comercio, al primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero y al ser tratado de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso. Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me(nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial en todo lo concerniente a los siguientes asuntos a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales, el registro de marcas de fábrica, colectivas defensivas y de servicios, el depósito de nombres comerciales y enseñanzas, su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria, y el registro de licencias de uso de esos derechos b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transgír, desistír, cancelar, recibir, renunciar y ratificar los actos hechos por agentes oficiosos.

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal
de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831, ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519, und EMILIO FERRERO, tpa. 31929, wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 843 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen 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, durch Abwesenheit, oder das Hindernis des Hauptvertreter, oder durch das Hindernis des zweiten oder dritten Stellvertreter, beziehungsweise, beendet, einer oder anderer Stellvertreter werden die Vertretung ausüben, mittelst Aussage, nur auf Grund sie auszuüben mit Ausnahme zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise. Ausserdem, unter denselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte, die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den ungerechten Wettbewerb zu dem Zweck, dass die genannten Bevollmächtigten ernennen, damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtssprechung ausüben oder nicht, vor ihnen von 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-, Handels-, Dienst- und Servicezeichen Aufbewahrung von Handelsnamen und -zeichen, ihre Erneuerung und Übertragung, Namen und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragsschluss, 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 erstatten, 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

BASF Aktiengesellschaft

[Signature]
ppa Welzel

[Signature]
Unterschrift
ppa Richters



U R Nr 1407/89

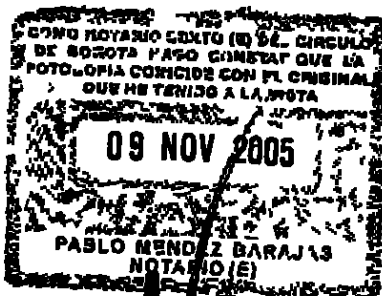
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorst.
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren

- 1 Dr 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



Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors
Thomas Walter

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

Frankenthal (Pfalz) den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)



Kostenvermerk Gebühr 20 -- DM



Handwritten notes and signatures on the right margin, including a date '10.11.2005' and a signature.



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

N-0077

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-----
cuien 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 BASF Aktiengesellschaft-----
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
de la República Federal de Alemania y cumple sus deberes
conforme a las mismas, que el(los) señor(es) Dr. Günther
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 Walter-----
----- es(son) su(s) representan-
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 ABR 1989

N-0077

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por 403 6 - das Land E 6 K K

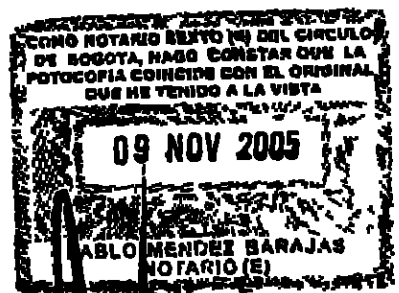


Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

RECEIVED

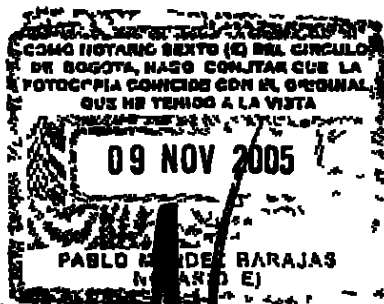
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
29 ABR 1988 No 85064
Antonia Nino
SECRETARIO

Antonio
ACUÑA
COMO NOTARIO SUJETO (A) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
09 NOV 2005
PABLO M. DE LA JAS
NOTARIO



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



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, BONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

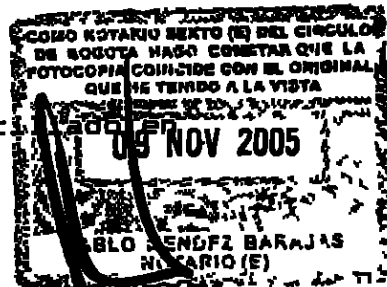
Protocolo notarial No 1407/B9

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

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

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona

LUZ ARRIAGA DE HERBES
TRADUCTORA INTERPRETE OFICIAL
Resolución No 599 Ministros



9

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr Siegfried Kohler

Fdo firma ilegible

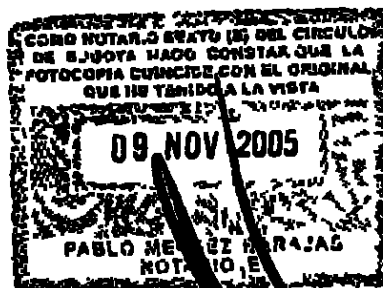
Notario de Ludwigshafen

Th Walter

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

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

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



El Presidente del Tribunal Regional

Fdp firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

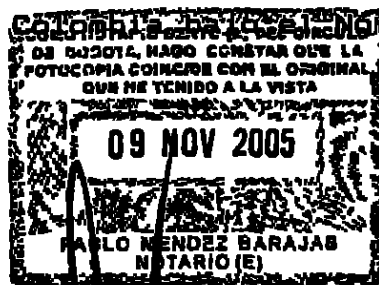
El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota Derrechos 20,-- DM

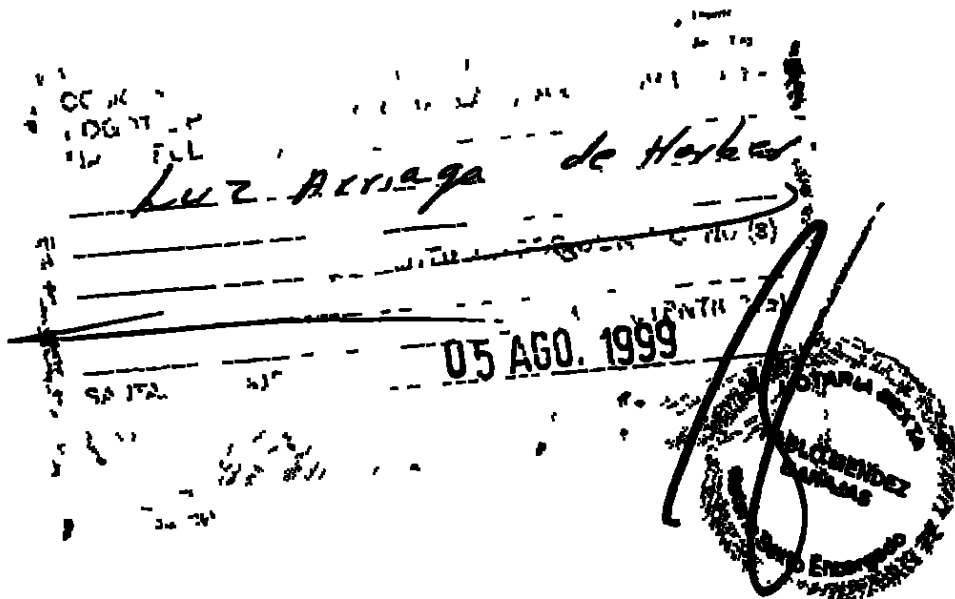
EN ESPAÑOL. La legalización de las firmas anteriores por el
Consulado de General de Colombia en Frankfurt, bajo el No
0077 (Certificación consular) del 6 de abril de 1989 y del
Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia, No 85061
del 24 de abril de 1989

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
Registro No 599 Ministerio



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá 28 MAR 1985 No. 89013

VICE CONETAS

Que el señor Luz DE HEREDIA
 cuya firma aparece en el presente
 documento, designa en esta fecha
 los siguientes como indicados

Encargado

10133

COMUNICADO (N) DEL CANCEL
 DE RELACIONES EXTERIORES CONSTATAR QUE LA
 FOTOCOPIA CONFORME CON EL ORIGINAL
 QUE HE TENIDO A LA VISTA

09 NOV 2005

PABLO MENDEZ PARAJAS
 NOTARIO

LEA LAS INSTRUCCIONES GENERALES
RECUERDE QUE TODOS LOS

REEMPLAZO DEL DONADOR DE ESTE FORMULARIO.
SI DEBEN ESTAR ALIBENCIADOS CON ALGUN VALOR, EN CASO CONTRARIO, ESCRIBA CERO (0)

881051599954



DECLARACION Y PAGO DEL

IMPUESTO D

16 013 01 000045 1

TIMBR NACIONAL

16 013 01 000045 1'

1	Administración de Impuestos de	Código	2	Teléfono	
	BOGOTA	0,3		2120100	
3	Documento de identificación (marque X)	D.V.	4	Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 80 caracteres).	
	C.C. & T.I. ☐ C ☐ NT ☒ A No. 860041367	3		CAVELIER ABOGADOS	
5	C.C. & T.I. ☐ C ☒ NT ☐ A No. 19'301.629	D.V.	6	Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 80 caracteres).	
				FORERO ROCHA JAIME	
7	Dirección (de la persona o entidad identificada en la celda 4)	Municipio	Departamento	8	Número documento
	Cra. 4a No. 72-35	BOGOTA	CUNDINAMARCA		1
9	Relacione el(los) tipo(s) de documento(s), indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción.				
	TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989				
	PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER				
	COLO 0361-52-218-8				

REVISADO
SE
CONSEJO
CONSEJAL

09 NOV 2005
PAULO BERNARDI
NOTARIO (F)

FIRMA	Responsable del pago
	Nombre
	C.C. No. 11-1112

1	VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	750
2	Sanciones	0
3	Intereses de mora	0
4	TOTAL PAGAR (Sumatoria de 2 + 3)	750
5	Forma de pago	
	Cheque ☐ No. ☒ Efectivo ☒	
6	Código	

1 037
*** 750.00

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª No 72 35

BOGOTA 8 COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL CAVE

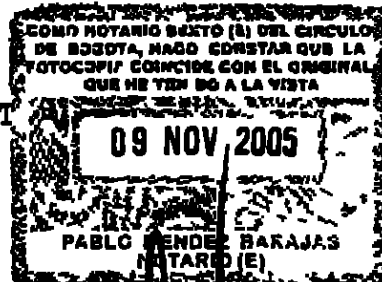
TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLES CAVELEYES

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

Poderdante BASF AKTIENSESELLSCHAFT

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 sustitucion conforme al articulo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER

T P A No 832

C C No 2 877 924 de Bogota

Acepto

EMILIO FERRERO

T P A No 31 929

C C No 438 019 de Usaquen

2e-780-2

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art 1ro del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá c. comparecio, el Doctor SM/10 F. R. A. M. A.

quien exhibio la cedula de su cedula numero 673991
expedida en U. A. D. U. V. y la tarjeta profesional
numero 31 929 del Ministerio de Justicia con
el presente documento dirigido a D. P. HUARIN (A. R. A. M. A.)
y declaró que la firma que aparece en el c. lya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art 1ro. del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá c. comparecio, el Doctor 673991

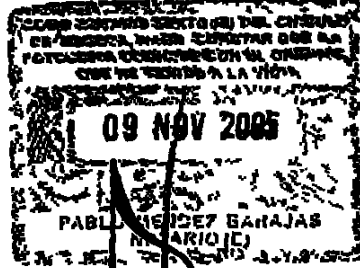
quien exhibio la cedula de ciudadania numero 207274
expedida en 27 y la tarjeta profesional
numero 637 del Ministerio de Justicia con
el presente documento dirigido a D. P. HUARIN (A. R. A. M. A.)
y declaró que la firma que aparece en el c. lya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



H

4867

4867

Colombia / 5

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

0000054547

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
Stockinger Str 7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr
Goethestr 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
Wassilos Grammenos
Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Thomas Grote
Im Höhenhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
Andreas Gypser
B 4 4 68159 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Joachim Rheinheimer
Merziger Str 24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
Peter Schäfer
Römerstr 1 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany
Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Germany
Citizen of Germany



domiciliado(s) en

Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str 3 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof
Germany
Citizen of Germany
Ulrich Schöfl
Erlenstr 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein
Germany
Citizen of Germany
Reinhard Stierl
Jahnstr 8, 67251 Freunsheim
Germany
Citizen of Germany

declaro(amos) bajo juramento ser unico(s) y verdadero(s)
 inventor(es) de la invención

PIRIMIDINAS 2-sustituídas

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

BASF AKTIENGESellschaft

constituida y existente de conformidad con las leyes de

Alemania

domiciliada en

67056 Ludwigshafen, Alemania

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

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

2-Substituted pyrimidines

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

04. Juli 2005

Firma

Signature



Jordi Tormo i Blasco



Carsten Bleitner



Bernd Müller



Markus Geyhr



Wassilios Grammenos



Thomas Grote



Andreas Gipsner



Joachim Rheinheimer



Peter Schäfer



Frank Schieweck

16

Anja Schwägler

Anja Schwägler

Oliver Wagner

Oliver Wagner

Siegfried Strathmann

Siegfried Strathmann

Ulrich Schöf

Ulrich Schöf

Maria Scherer

Maria Scherer

Reinhard Stierl

Reinhard Stierl

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WFFODERE-343

CO Amalgamated Form 01 11/98

U R Nr 1602/2005

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, Citizen of Spain, personally known to me,
- 2 Mr Carsten **Blöttner**, residing at Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
- 3 Mr Bernd **Müller**, residing at Stockinger Str 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
- 4 Mr Markus **Gewehr**, residing at Goethestr 21, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
- 5 Mr Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
- 6 Mr Thomas **Grote**, residing at Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
- 7 Mr Andreas **Gypsen**, 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 **Schwögler**, residing at Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,

- 8
- 12 Mr Oliver **Wagner**, residing at Im Meisental 50,
67433 Neustadt, 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 Erlenstr 8, 68782
Brühl, Germany, personally known to me
 - 15 Mrs Maria **Scherer**, residing at Hermann-Jürgens-
Str 30, 76829 Godramstein, Germany, personally
known to me,
 - 16 Mr Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstr 8,
67251 Freinsheim, Germany, personally known to
me,

are true and valid

Ludwigshafen/Rhine, this 4th day of July, 2005



notary public

Wert 5 112,92 €

APOSTILLE

(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 19 Juli 2005**
- 7 durch den Präsidenten des Landgerichts**
- 8 unter Nr 91 Eb - 830-847/05**

9 Siegel/Stempel

10 Unterschrift
Im Auftrag



(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk
Gebühr 12,-- €

TRADUCCIÓN OFICIAL 256/2005 DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL APROBADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE LA REPÚBLICA DE COLOMBIA Y MEDIANTE EL CUAL JORDI TORMO I BLASCO, CARL-BENZ-STR 10-3, 69514 LAUDENBACH, ALEMANIA, CIUDADANO ESPAÑOL, CARSTEN BLETTNER, RICHARD-WAGNER-STR 48, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, BERND MÜLLER STOCKINGERSTR 7, 67227, FRANKENTHAL, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; MARKUS GEWEHR, GOETHESTR 21, 56288 KASTELLAUN, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, WASSILIOS GRAMMENOS, ALEXANDER-FLEMING-STR 13, 67071 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, CIUDADANO GRIEGO, THOMAS GROTE, IM HÖHNHAUSEN 18, 67157 WACHENHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO DE ALEMANIA, ANDREAS GYSER, B4, 4, 68159 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, JOACHIM RHEINHEIMER, MERZIGER STR 24, 67063 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, PETER SCHÄFER, RÖMERSTR 1, 67308 OTTERSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, FRANK SCHIEWECK LINDENWEG 4, 67258 HESSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, ANJA SCHWÖGLER, HEINRICH-LANZ-STR 3, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; OLIVER WAGNER, IM MEISENTAL 50, 67433 NEUSTADT, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, EBERHARD AMMERMAN, VON-GAGERN-STR 2, 64646 HEPPENHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; SIEGFRIED STRATHMANN, DONNERSBERGSTR 9 67117 LIMBURGERHOF, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, ULRICH SCHÖFL, LUFTSCHIFFRING 22C, 687882 BRÜHL, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; MARÍA SCHERER, HERMANN-JÜRGENS-STR 30, 76829 LANDAU, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, REINHARD STIERL JAHNSTR 8, 67251 FREINSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN INVENTORES ÚNICOS Y VERDADEROS DE LA INVENCION PIRAMIDINAS 2-SUSTITUIDAS DECLARAN POR EL PRESENTE QUE CEDEN DICHA INVENCION SIN RESERVAS NI

LIMITACIONES EN FAVOR DE **BASF AKTIENGESSELLSCHAFT** EMPRESA ORGANIZADA Y EXISTENTE BAJO LAS LEYES DE ALEMANIA, DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, JUNTO CON TODOS LOS DERECHOS INHERENTES Y QUE DICHA COMPAÑÍA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE EN LA REPÚBLICA DE COLOMBIA DADO Y FIRMADO HOY 4 DE JULIO DE 2004

FIRMADO JORDI TORMO I BLASCO, CARSTEN BLETTNER, BERND MÜLLER, MARKUS GEWEHR, WASSILIOS GRAMMENOS, THOMAS GROTE, ANDREAS GYPSE, JOACHIM RHEINHEIMER, PETER SCHÄFER, FRANK SCHIEWECK, ANJA SCHWÖGLER, OLIVER WAGNER, SIEGFRIED STRATHMANN, ULRICH SCHÖFL, MARIA SCHERER Y REINHARD STIERL

AUTENTICACIÓN NOTARIAL

DADO Y FIRMADO HOY 4 DE JULIO DE 2005 POR JORDI TORMO I BLASCO, CARSTEN BLETTNER, BERND MÜLLER, MARKUS GEWEHR, WASSILIOS GRAMMENOS, THOMAS GROTE, ANDREAS GYPSE, JOACHIM RHEINHEIMER, PETER SCHÄFER, FRANK SCHIEWECK, ANJA SCHWÖGLER, OLIVER WAGNER, SIEGFRIED STRATHMANN, ULRICH SCHÖFL, MARIA SCHERER Y REINHARD STIERL,

Firmado (notario público)

Ludwig Draxel-Fischer, notario

URK R NR 1602/2005

Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente certifico y confirmo que las firmas anteriores de

1 JORDI TORMO I BLASCO, CARL-BENZ-STR 10-3, 69514 LAUDENBACH, ALEMANIA, personalmente conocido mío

2 CARSTEN BLETTNER, RICHARD-WAGNER-STR 48, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, personalmente conocido mío

3 BERND MÜLLER STOCKINGERSTR 7, 67227, FRANKENTHAL, ALEMANIA, personalmente conocido mío;

- 4 MARKUS GEWEHR, GOETHESTR 21, 56288 KASTELLAUN, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,
- 5 WASSILIOS GRAMMENOS, ALEXANDER-FLEMING-STR 13, 67071
LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, personalmente conocido mío
- 6 THOMAS GROTE, IM HÖHNHAUSEN 18, 67157 WACHENHEIM, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,
- 7 ANDREAS GYSER, B4, 4,68159 MANNHEIM, ALEMANIA, personalmente
conocido mío,
- 8 JOACHIM RHEINHEIMER, MERZIGER STR 24, 67063 LUDWIGSHAFEN,
ALEMANIA, personalmente conocido mío,
- 9 PETER SCHÄFER, RÖMERSTR 1, 67308 OTTERSHEIM, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,
- 10 FRANK SCHIEWECK LINDENWEG 4, 67258 HESSHEIM, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,
- 11 ANJA SCHWÖGLER, HEINRICH-LANZ-STR 3, 68165 MANNHEIM,
ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, personalmente conocida mía,
- 12 OLIVER WAGNER, IM MEISENTAL 50, 67433 NEUSTADT, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,
- 13 SIEGFRIED STRATHMANN, DONNERSBERGSTR 9 67117 LIMBURGERHOF,
ALEMANIA, personalmente conocido mío,
- 14 ULRICH SCHÖFL, LUFTSCHIFFRING 22C, 687882 BRUHL, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,
- 15 MARÍA SCHERER, HERMANN-JÜRGENS-STR 30, 76829 LANDAU,
ALEMANIA, personalmente conocida mía,
- 16 REINHARD STIERL JAHNSTR 8, 67251 FREINSHEIM, ALEMANIA,
personalmente conocido mío,

Ludwigshafen on Rhine, 4 de julio de 2005

Firmado (ilegible)

Valor 5 112,92 euros

NOTA DE APOSTILLA # 91 EB-830-847/05 ✓

19 de julio de 2005

FIRMADO CHRISTIAN KÖNEKE

COLO-00361-841-063-7

WPCL002G ID 7242

Bogotá, 4 de noviembre de 2005

Eduardo Calado
Eduardo Calado Reguera
"TRADUCTOR OFICIAL"
ESPAÑOL - ESPAÑOL
Res. 341 Febrero de 1991

2005-11-23

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

30335
Edoardo Caballero
FIRMA AFABECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

VO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
11 NOV 2005
Edoardo Caballero
Jefe de Legación
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO D...
BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ...
Edoardo Caballero
COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTAFÉ DE BOGOTÁ 11 NOV 2005

[Signature]
NOTARIA SEXTA
ABLO MENDEZ
BARAJAS
Notario Sexto

TRADUCCION OFICIAL No 11912

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

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

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

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

25
2

-Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Siegfried Strathmann,
domiciliado en Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof, Alemania,
Ciudadano de Alemania,
- Ulrich Schöfl
domiciliado en Erlenstr 8, 68782 Brühl, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Maria Scherer
domiciliada en Hermann-Jürgens-Str 30, 76829 Godramstein, Alemania
Ciudadana de Alemania
- Reinhard Stierl
domiciliado en Jahnstr 8, 67251 Freinsheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

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

Pirimidinas 2-sustituidas

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia Hay dieciséis firmas ilegibles Dado y firmado el 04 de julio 2005

Autenticación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notano de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 04 de julio 2005, bajo el - --
No 1602/2005 (Hilo y oblea notarial) Valor 5 112,92 Euros

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1 País Republica Federal de Alemania

Este documento publico

2 Ha sido firmado por el notano Draxel-Fischer

3 Actuando en calidad de notano publico

LUZ ABRIAGA DE HEREDIA
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No 568 Minjusticia

26

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

Certificado

5 en Frankenthal (Pfalz)

6 el 19 de julio 2005

7 por el Presidente del Tribunal Regional

8 bajo el No 91 Eb - 830-847/05

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, 07 de noviembre 2005

C 2808

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
[Firma manuscrita]
Resolución No 699 Minjusticia

20371
Luz Amaga
CONCEPCION
PERU
SANCHEZ, ROSAS

5127-1-ACI-7
 CALIFICACIONES
 11-DC

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
2. Dezember 2004 (02.12.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/103978 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷ C07D 239/48
403/14 403/04 491/113 A01N 43/54, 43/653

(21) Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/004957

(22) Internationales Anmeldedatum
10. Mai 2004 (10.05.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität
103 23 026 2 20. Mai 2003 (20.05.2003) DE

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

(72) Erfinder, und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I. BLASCO,
Jordi [ES/DE] Carl-Benz-Str. 10-3 69514 Laudendach
(DE); BLETTNER, Carsten [DE/DE] Richard-Wag-
ner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE); MÜLLER, Bernd
[DE/DE] Stockinger-Str. 7, 67227 Frankenthal (DE);
GFWFHR Markus [DE/DE] Goethestr. 21 56288
Kastellaun (DE); GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE);
GROTE, Thomas [DE/DE] Im Hühnhäusen 18, 67157
Wachenheim (DE); GYPSE, Andreas [DE/DE] B4,4
68159 Mannheim (DE); RHEINHEIMER, Joachim
[DE/DE] Murriger-Str. 24 67063 Ludwigshafen (DE);
SCHAFFER Peter [DE/DE] Römerstr. 1 67308 Otter-
heim (DE); SCHIEWECK, Frank [DE/DE] Lindenweg

4 67258 Hessheim (DE); SCHWOGLER, Anja [DE/DE]
Heinrich-Lanz-Str. 3 68165 Mannheim (DE); WAGNER,
Oliver [DE/DE] Im Meisental 50 67433 Neustadt (DE);
STRATHMANN, Siegfried [DE/DE] Donnersbergstr. 9
67117 Limburgerhof (DE); SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]
Luftschiffweg 22c 68782 Brühl (DE); SCHERER, Martin
[DE/DE] Hermann-Jürgens-Strasse 30, 76829 Godram-
stein (DE); STIERL, Reinhard [DE/DE] Jahnstr. 8,
67251 Freinsheim (DE).

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

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DI, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LI, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), europäisches (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

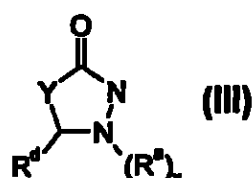
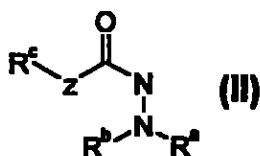
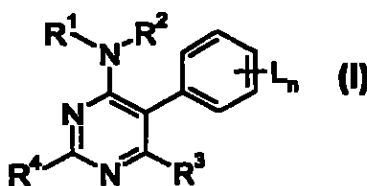
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 2 SUBSTITUTED PYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: 2 SUBSTITUIERTE PYRIMIDINE

104243

WRL0361



(57) Abstract: The invention relates to pyrimidines of formula (I), in which the index n and the constituents L, R¹ to R³ are defined as cited in the description and R⁴ corresponds to one of the formulas (II)–(III). The invention also relates to methods and intermediate products for producing said compounds to agents containing the latter and to their use for controlling phytopathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Pyrimidine der Formel (I) in der der Index n und die Substituenten L, R¹, R², die in der Beschreibung gegebene Bedeutung haben und R⁴ einer der Formeln (II)–(III) entspricht, sowie Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze.

WER

WO 2004/103978 A1

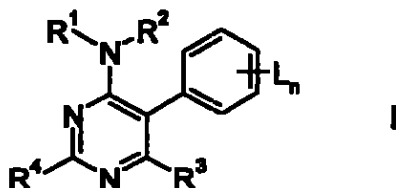


Zur Erklärung der Zweibuchstaben Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT Gazette verwiesen.

2-Substituierte Pyrimidine

Beschreibung

5 Die Erfindung betrifft 2-substituierte Pyrimidine der Formel I,



in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben

- 10 n eine ganze Zahl von 1 bis 5, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt;
- 15 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), Nitro, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A oder S(=O)_m-N(A')A,
- 20 m 0, 1 oder 2,
- 25 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können, oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen,
- 30 wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R^u tragen können
- 35 R^u Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkoxy, C₃-C₈-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A oder S(=O)_m-N(A')A, wobei m, A, A', A'' die vorgenannte Bedeutung haben und wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine

bis drei Gruppen R^v tragen können, wobei R^v die gleiche Bedeutung wie R^u besitzt;

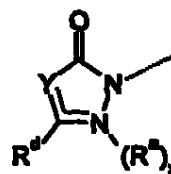
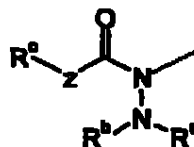
5 R^1, R^2 unabhängig voneinander C_1-C_6 -Alkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_3-C_6 -Halogencycloalkyl, C_2-C_6 -Halogenalkenyl oder C_2-C_6 -Halogenalkynyl,

R^2 kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten,

10 R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedigen Ring bilden, der durch eine Ether-(-O-), Carbonyl -C(=O)-, Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S(=O)-) oder Sulfenyl-(-SO₂-) Gruppe unterbrochen sein kann,

15 R^3 Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, C_2-C_4 -Alkenyl, C_2-C_4 -Alkynyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_3-C_4 -Alkenyloxy oder C_3-C_4 -Alkynyloxy, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynyreste von R^3 durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_2 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxy-carbonyl substituiert sein können,

20 R^4 einer der Formeln



25 entspricht, wobei

x 0 oder 1 bedeutet;

30 R^a, R^b und R^c unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_4-C_6 -Cycloalkenyl,

R^a, R^b zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, die Bedeutung $R^c-Z-C(R^d)=N$ haben können,

35 Z Sauerstoff oder N- R^e bedeutet;

Y C(H)- R^e , C- R^e , N-N(H)- R^e oder N- R^e bedeutet,

— eine Doppel oder Einfachbindung bedeuten kann,

R^d , R^e die gleiche Bedeutungen wie R^c haben und zusätzlich Halogen oder Cyano bedeuten können,

5 R^d zusammen mit dem Kohlenstoff an das es gebunden ist, eine Carbonylgruppe bedeuten kann,

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^a , R^b , R^c , R^d oder R^e ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert
10 sein oder eine bis vier Gruppen R^w tragen können

R^w Halogen, Cyano, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_{10} -Alkenyl, C_2-C_{10} -Alkynyl, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_{10} -Alkenyloxy, C_2-C_{10} -Alkynyloxy, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Cycloalkenyl, C_3-C_6 -Cycloalkoxy, C_3-C_6 -Cycloalkenyloxy, und wobei
15 zwei der Reste R^a , R^b oder R^c zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, bilden können

20 Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze

Aus WO-A 01/86314 sind fungizide Pyrimidine, die in 2-Stellung einen Cyanamino-
25 substituenten tragen, bekannt. Weiterhin sind aus WO 02/74753 fungizide Pyrimidine bekannt, die in 2-Stellung allgemein einen Heterocyclylrest tragen. Spezifisch offenbart sind allerdings nur Heteroaryl substituierte Pyrimidine

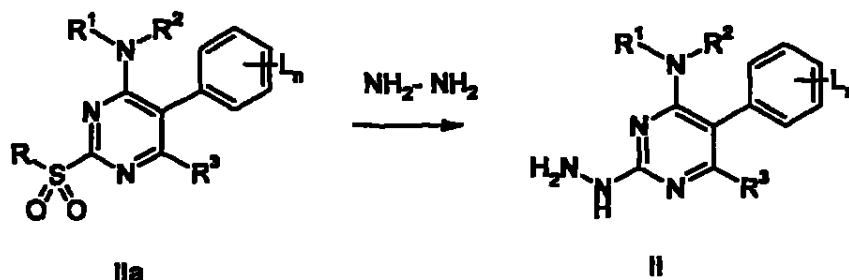
Die Wirkung der o.g. Pyrimidine ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden
30

Demgemäß wurden die eingangs definierten Pyrimidine der Formel I gefunden. Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen gefunden
35

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden

1) Beispielsweise kann von den Hydrazinopyrimidinen der Formel II ausgegangen werden, deren Herstellung in WO-A 02/074753 oder DE 10156279 9 detailliert be-

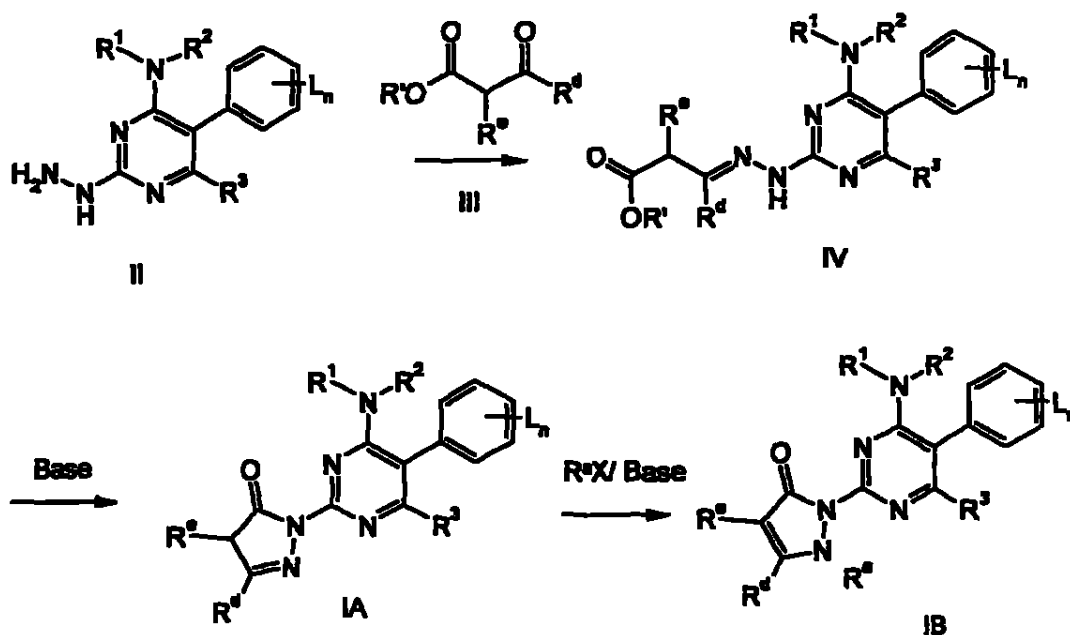
schrieben ist. Im folgenden ist eine bevorzugte Herstellung der Verbindungen II ausgehend von den Sulfonen IIa aufgezeigt.



Die weitere Synthese kann wie in Schema 1 dargestellt erfolgen

5

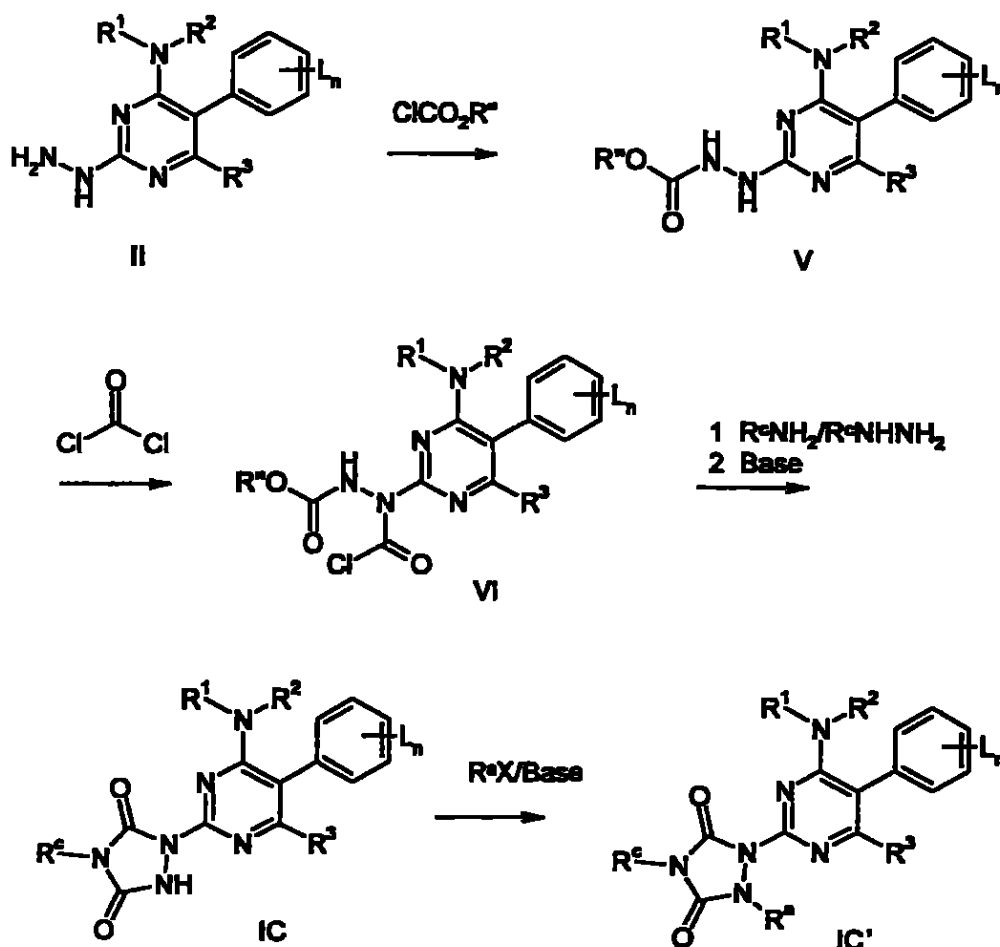
Schema 1



- Die Hydrazinverbindung II wird mit einer Dicarboxylverbindung III, wobei die Substituenten R¹, R², R³, L_n, R^d und R^e die zuvor gegebene Bedeutung haben und R' eine Alkyl, Aryl oder Benzylgruppe bedeutet, kondensiert (s. Schema 1) und damit die Verbindungen der Formel VI erhalten. Die Dicarboxylverbindungen der Formel III sind aus *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* 1989 28, S. 500 bekannt. Die Kondensation erfolgt wie unter DE 19627002 im näheren ausgeführt. Der Ringschluss zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IA erfolgt beispielsweise in Gegenwart von Basen wie insbesondere Alkalimetallalkoxydate. Explizit beschrieben wird die Umsetzung mit Natriummethylat (*Synlett* 1996, 667-8) in Gegenwart von Alkylierungsmittel R''X, wobei R'', die o g Bedeutung und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, oder Sulfat steht und einer starken Base wie beispielsweise Natriumhydrid oder wasserfreiem Kaliumcarbonat werden die erfindungsgemäßen Verbindungen IB erhalten.

2) Das in Schema 2 aufgezeigte Herstellverfahren führt zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IC

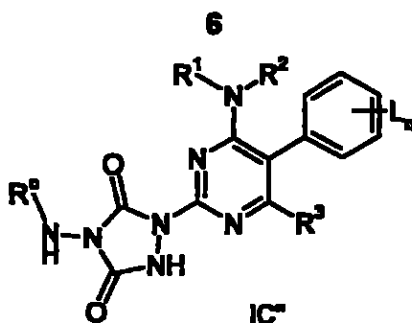
Schema 2.



5

Ausgangspunkt für die Synthese der Verbindungen IC und IC' ist vorzugsweise die Hydrazinverbindung II, deren Herstellung bereits weiter oben eingehend beschrieben wird. Die Umsetzung mit Chlorameisensäureester (R' steht für einen Alkylrest) zu den acylierten Verbindungen V erfolgt im allgemeinen in Gegenwart einer Base. Die weitere Umsetzung von V mit Phosgen bzw. einem Phosgenäquivalent zu VI und der anschließende Ringschluss in Gegenwart eines Amins/Hydrazins und einer Base kann analog der in *Chem Ber* 1898, 31, Seite 2320 ff beschriebenen Methode erfolgen. Der Ringschluss in Gegenwart von Aminen R^eNH_2 führt zu Triazolidindionen IC während der Ringschluss in Gegenwart von Hydrazinen R^eNH-NH_2 zu den Verbindungen IC' führt.

10

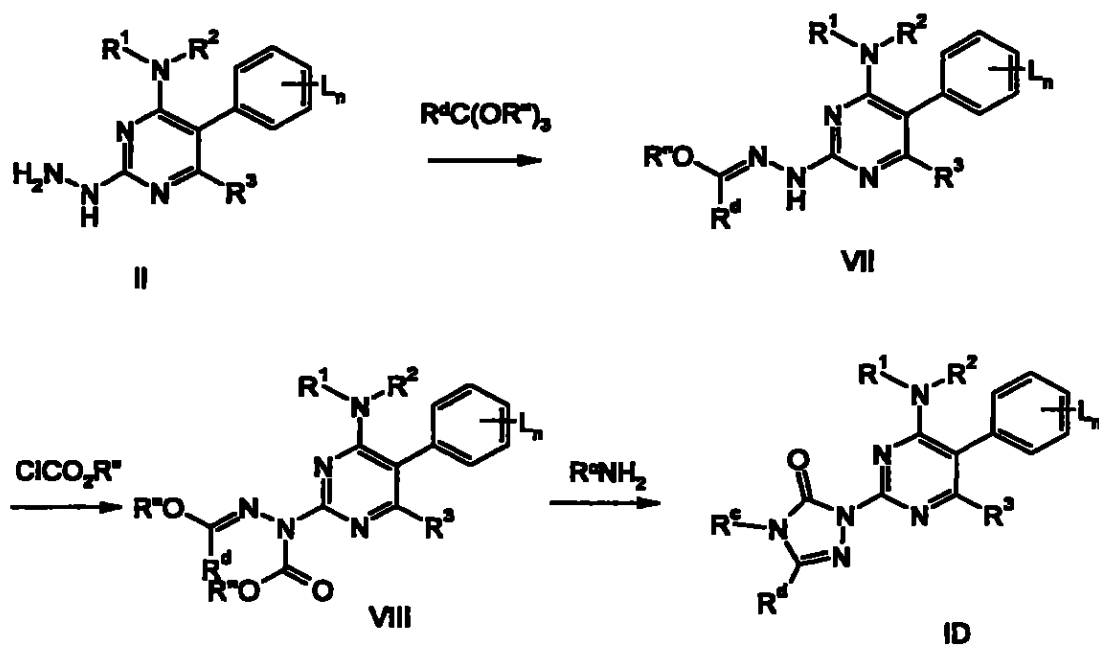


Die Alkylierung der Verbindungen IC mit Alkylierungsmittel R^aX , wobei R^a die o g Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid oder Sulfat steht, in Gegenwart von Base erfolgt nach DE 3336693

5

3) Triazolidinone des Typs ID lassen sich vorteilhaft wie in Schema 3 gezeigt aufbauen

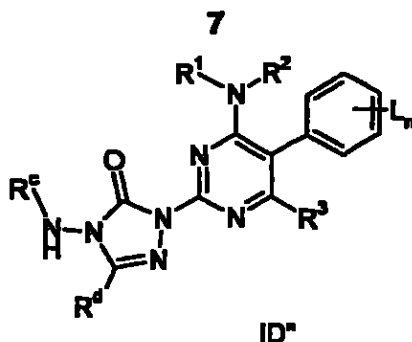
Schema 3



10

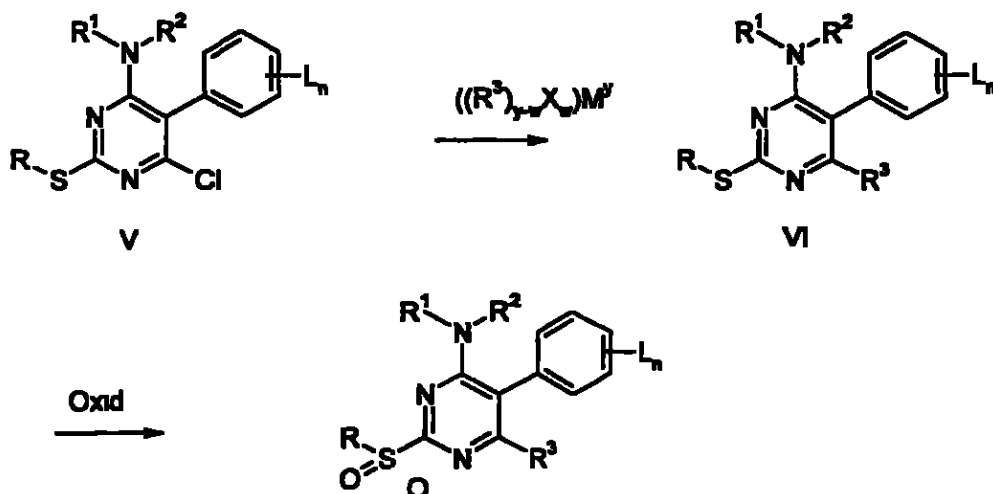
Ausgehend von der Hydrazinverbindung II und Orthoestern erhält man die kondensierte Verbindung VII analog der in *J Am Chem Soc.* 1995, 77, S 1148 beschriebenen Methode VII wird weiterhin mit Chlorameisensäureester zu VIII analog zu der in *Compt Rend Acad Sci.* 1981, 293, N8, 573-76 beschriebenen Methode acyliert R' im Orthoester und Chlorameisensäureester bedeutet C₁-C₈-Alkyl Der Ringschluss zu den erfindungsgemäßen Verbindungen ID erfolgt in Gegenwart von Aminen R^eNH₂ Werden anstelle von Aminen Hydrazine der Formel R^eNH-NH₂ eingesetzt, so werden Triazolidinone der Formel ID'' erhalten

15



- Der Rest R³ (insbesondere Alkyl) in 6-Position am Pyrimidinring kann durch Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse eingeführt werden. In manchen Fällen kann es ratsam sein die Reihenfolge umzudrehen und den Substituenten R³ vor dem Substituenten NR¹R² einzuführen

Schema 4



10

- In Formel (R³)_wX_wM^Y steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn, Mg, Cu oder Sn, X steht für Chlor, Brom, Iod oder Hydroxy, R³ bedeutet bevorzugt C₁-C₄-Alkyl und w steht für eine Zahl von 0 bis 3. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996), WO-A 98/41255, Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990), J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978), J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979), Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993), ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- Die obengenannten Angaben beziehen sich insbesondere auf die Herstellung von Verbindungen, in denen R³ eine Alkylgruppe darstellt. Sofern R³ eine Cyangruppe oder einen Alkoxy-substituenten bedeutet, kann der Rest R³ durch Umsetzung mit Alkalimetallcyaniden bzw. Alkalimetallalkoholaten eingeführt werden.

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

5

Halogen Fluor, Chlor, Brom und Jod,

Alkyl gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C_1 - C_8 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl,

Halogenalkyl geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C_1 - C_8 -Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-difluormethyl, 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,

Alkenyl ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_8 -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-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-

Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl,

Alkadienyl ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in beliebiger Position,

10

Halogenalkenyl ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können,

15

Alkynyl geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_8 -Alkynyl wie Ethynyl, 1-Propynyl, 2-Propynyl, 1-Butynyl, 2-Butynyl, 3-Butynyl, 1-Methyl-2-propynyl, 1-Pentynyl, 2-Pentynyl, 3-Pentynyl, 4-Pentynyl, 1-Methyl-2-butynyl, 1-Methyl-3-butynyl, 2-Methyl-3-butynyl, 3-Methyl-1-butynyl, 1,1-Dimethyl-2-propynyl, 1-Ethyl-2-propynyl, 1-Hexynyl, 2-Hexynyl, 3-Hexynyl, 4-Hexynyl, 5-Hexynyl, 1-Methyl-2-pentynyl, 1-Methyl-3-pentynyl, 1-Methyl-4-pentynyl, 2-Methyl-3-pentynyl, 2-Methyl-4-pentynyl, 3-Methyl-1-pentynyl, 3-Methyl-4-pentynyl, 4-Methyl-1-pentynyl, 4-Methyl-2-pentynyl, 1,1-Dimethyl-2-butynyl, 1,1-Dimethyl-3-butynyl, 1,2-Dimethyl-3-butynyl, 2,2-Dimethyl-3-butynyl, 3,3-Dimethyl-1-butynyl, 1-Ethyl-2-butynyl, 1-Ethyl-3-butynyl, 2-Ethyl-3-butynyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propynyl,

20

25

Cycloalkyl, mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C_3 - C_8 -Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl,

30

fünf- bis sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclen, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S

35

- **5- oder 6-gliedriger Heterocyclenyl**, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isotiazolidinyl, 4-

40

- Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isloxazolin-3-yl, 3-Isloxazolin-3-yl, 4-Isloxazolin-3-yl, 2-Isloxazolin-4-yl, 3-Isloxazolin-4-yl, 4-Isloxazolin-4-yl, 2-Isloxazolin-5-yl, 3-Isloxazolin-5-yl, 4-Isloxazolin-5-yl, 2-Issothiazolin-3-yl, 3-Issothiazolin-3-yl, 4-Issothiazolin-3-yl, 2-Issothiazolin-4-yl, 3-Issothiazolin-4-yl, 4-Issothiazolin-4-yl, 2-Issothiazolin-5-yl, 3-Issothiazolin-5-yl, 4-Issothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Pipendinyl, 4-Pipendinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl,
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isloxazolyl, 4-Isloxazolyl, 5-Isloxazolyl, 3-Issothiazolyl, 4-Issothiazolyl, 5-Issothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl,
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-

Pyndinyl, 4-Pyndinyl, 3-Pyndaznyl, 4-Pyndaznyl, 2-Pymidinyl, 4-Pymidinyl, 5-Pymidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl,

5 In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Racemate ($\pm$) von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen

Im folgenden werden die Ausführungsformen der Erfindung genauer beschrieben

10 Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Pymidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt

15 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R^1 für einen C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder C_3-C_6 -Cycloalkyl und R^2 für Wasserstoff stehen

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für in α -Stellung verzweigtes C_1-C_6 -Alkyl oder C_1-C_6 -Halogenalkyl steht.

20 Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für C_1-C_6 -Halogenalkyl und R^2 für Wasserstoff stehen

25 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoff, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauerstoffatom unterbrochen sein kann und einen oder zwei C_1-C_6 -Alkylsubstituenten tragen kann

30 Insbesondere bevorzugt sind Gruppen NR^1R^2 wie – insbesondere in α -Stellung – methylierte Pyrrolidine oder Pipedine

Außerdem werden Pymidine I besonders bevorzugt, wobei der Index n und die Substituenten L^1 bis L^5 die folgende Bedeutung haben

35 n 1 bis 3,
L Halogen, Cyano, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_{10} -Alkenyl, C_2-C_{10} -Alkynyl, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_{10} -Alkenyloxy, C_2-C_{10} -Alkynyloxy, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Cycloalkenyl, C_3-C_6 -Cycloalkoxy, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$ oder $S(=O)_m-A$,

m 0, 1 oder 2,

5 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können, oder A und A' zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind für einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N, oder S, stehen

10

Insbesondere werden Pymidine I bevorzugt, wobei die Substituenten L¹ bis L⁵ die folgende Bedeutung haben

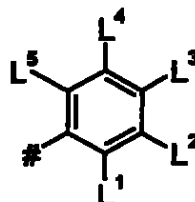
15 L Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, m 0, 1 oder 2, A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl

20 Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R^u für Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA) steht, wobei die aliphatischen oder alicyclischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^v tragen können, wobei R^v die gleiche Bedeutung wie R^u besitzt.

25

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^u für Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyloxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, steht

30 Außerdem werden Pymidine I bevorzugt, wobei die durch L_n substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



B

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

35 L¹ Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃,
L², L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, CH₃ oder Fluor;

- L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $CO-NH_2$, $CO-NHCH_3$, $CO-NHC_2H_5$, $CO-N(CH_3)_2$, $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ oder $COOCH_3$ und
- L^5 Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH_3 bedeuten

5

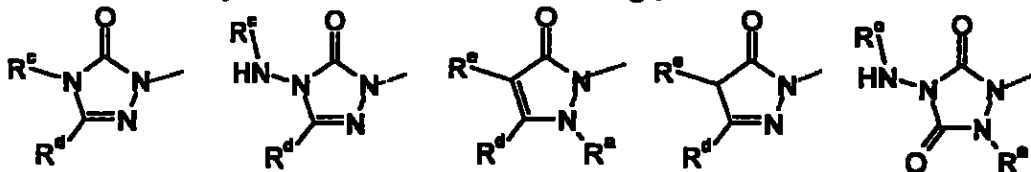
Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen R^3 C_1-C_4 -Alkyl bedeutet, das durch Halogen substituiert sein kann

- Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^3 für Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_4 -Alkoxy steht.

10

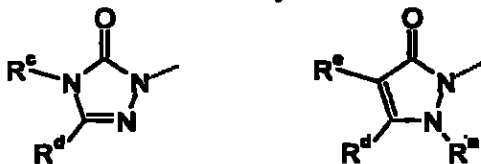
Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^3 Methyl, Ethyl, Cyano, Brom oder insbesondere Chlor bedeutet.

- 15 Weiterhin sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R^4 für



steht.

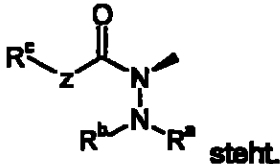
Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R^4 für



20

steht.

Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R^4 für Formel



steht.

25

R^a , R^b und R^c bedeuten vorzugsweise unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_8 -Alkenyl, C_2-C_8 -Alkynyl oder C_3-C_8 -Cycloalkyl

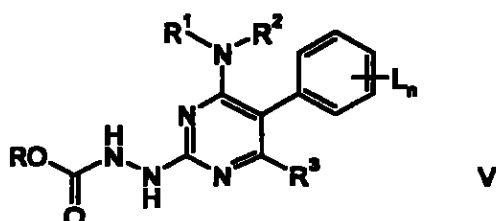
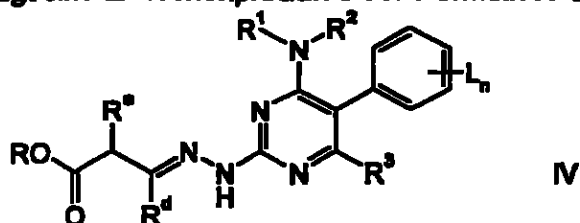
- Bevorzugt bedeuten R^a , R^b und R^c unabhängig voneinander Wasserstoff, Methyl oder Ethyl

30

Für die Zwischenprodukte der Formel IV, V, VI und VII gelten die gleichen Bevorzugungen wie für die Wirkstoffe die zuvor genannt wurden. Dabei gelten die bevorzugten Substituentenbedeutungen jeweils für sich wie auch in Kombination mit anderen Bevorzugungen.

5

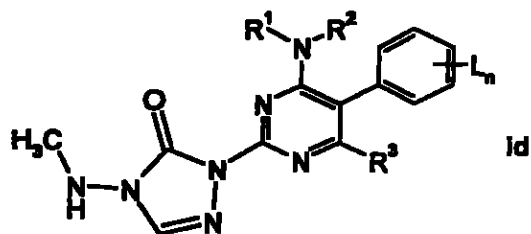
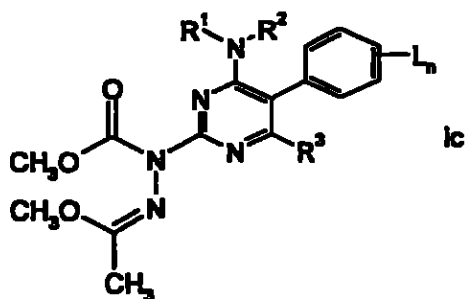
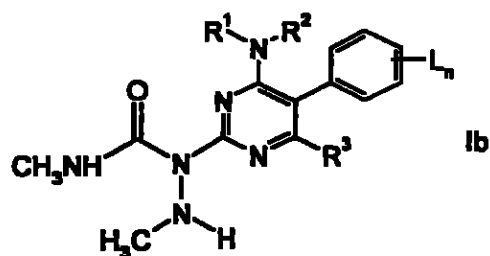
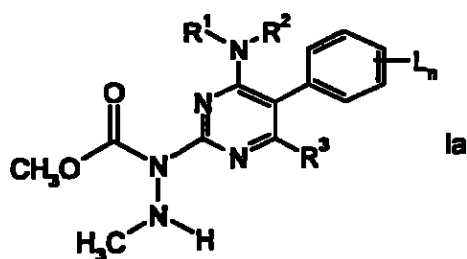
Insbesondere bevorzugt sind Zwischenprodukte der Formeln IV und V

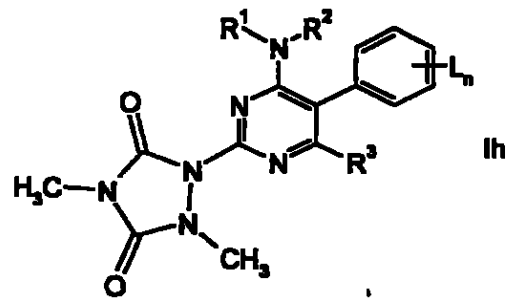
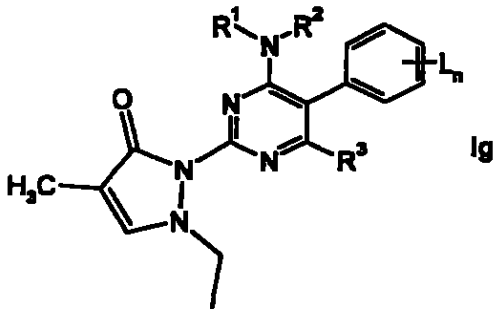
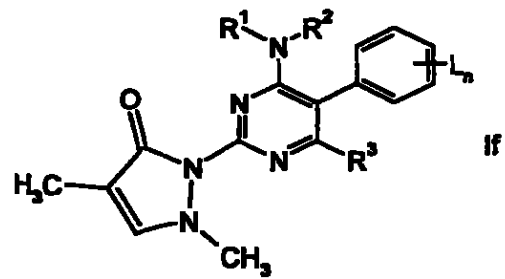
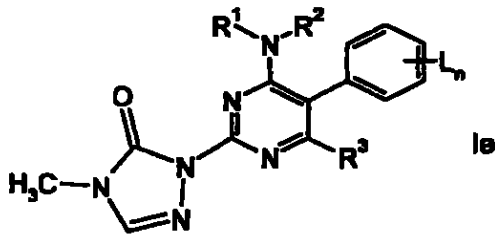


10

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.

15





Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor, 6-chlor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 1

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 2

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dichlor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 3

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor, 6-methyl, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 4

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trifluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 5

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-fluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 6

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-methoxycarbonyl, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 7

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-CN, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 8

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,5-Trifluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 9

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dichlor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 10

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 **Tabelle 11**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 12

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Difluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-chlor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 14

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor-4-fluor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 15

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3-Difluor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 16

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Difluor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 17

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3,4-Trifluor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 18

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 19

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dimethyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 20

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl-4-chlor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 21

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-methyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 22

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dimethyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 23

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trimethyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 24

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-cyano, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 25

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 26

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 27

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Methoxy, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 28

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Methyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 29

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Chlor,4-methoxycarbonyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 30

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Chlor,4-Brom, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 31

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Chlor,4-Cyan, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 32

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,6-Difluor,4-methoxy, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 33

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,3-methyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 34

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,5-Dimethyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 35

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-Cyan, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 36

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-brom, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 37

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,5-fluor, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 38

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-methoxy, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 39

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-methoxycarbonyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 40

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,5-Dimethyl,4-brom, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 41

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-brom, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 42

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-methoxy, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 43

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,5-methyl, R³ Methyl bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n Pentafluor, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 45

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,6-chlor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 46

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 47

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dichlor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 48

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,6-methyl, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 49

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trifluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 50

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-fluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 51

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-methoxycarbonyl, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 52

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-CN, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 53

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,5-Trifluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 54

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dichlor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 **Tabelle 55**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 56

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 57

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Difluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 58

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-chlor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 59

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor-4-fluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 60

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3-Difluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 61

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Difluor, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 62

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3,4-Trifluor, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 63

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 **Tabelle 64**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dimethyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 **Tabelle 65**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl-4-chlor, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 **Tabelle 66**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-methyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 **Tabelle 67**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dimethyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 **Tabelle 68**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trimethyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 69

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2,6-Difluor-4-cyano, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 70

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2,6-Difluor-4-methyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 71

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 72

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2-Chlor,4-Methoxy, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 73

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2-Chlor,4-Methyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 74

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2-Chlor,4-methoxycarbonyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 75

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2-Chlor,4-Brom, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 76

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L, 2-Chlor,4-Cyan, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 77

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor,4-methoxy, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 78

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,3-methyl, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 79

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Dimethyl, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 80

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-cyan, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 81

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-brom, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 82

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,5-fluor, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 83

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-methoxy, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 84

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-methoxycarbonyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 85

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,5-Dimethyl,4-brom, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 86

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-brom, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 87

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-methoxy, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 88

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,5-methyl, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 89

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-Pentafluor, R³ Chlor bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 90

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,6-chlor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 91

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,6-Difluor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 92

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dichlor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 93

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,6-methyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle 94

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trifluor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 95

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-fluor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 96

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-methoxycarbonyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 97

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-CN, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 98

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,5-Trifluor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 99

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dichlor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 100

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 101

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 102

- 10 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Difluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

Tabelle 103

- 15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-chlor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

Tabelle 104

- 20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor-4-fluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

Tabelle 105

- 25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3-Difluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

Tabelle 106

- 30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Difluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

Tabelle 107

- 35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3,4-Trifluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

Tabelle 108

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 109

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dimethyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 110

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl-4-chlor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 111

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-methyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 112

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dimethyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 113

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trimethyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 114

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-cyano, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 115

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 116

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-Methoxycarbonyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 117

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Methoxy, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 118

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Methyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 119

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-methoxycarbonyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 120

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Brom, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 121

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Cyan, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 122

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor,4-methoxy, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 123

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,3-methyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 124

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Dimethyl, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 125

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-Cyan, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 126

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-brom, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 127

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,5-fluor, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 128

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-methoxy, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 129

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-methoxycarbonyl, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 130

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Dimethyl,4-brom, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 131

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-brom, R^3 Brom bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 132

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-methoxy, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 133

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,5-methyl, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 134

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-Pentafluor, R³ Brom bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 135

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,6-chlor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 136

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,6-Difluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 137

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,6-Dichlor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 138

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,6-methyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 139

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,4,6-Trifluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 140

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl,4-fluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 141

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-methoxycarbonyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 142

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor,4-CN, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 143

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,5-Trifluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 144

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dichlor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 **Tabelle 145**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 146

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 147

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Difluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 148

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-chlor, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 149

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor-4-fluor, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 150

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3-Difluor, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 151

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,5-Difluor, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 152

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,3,4-Trifluor, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 153

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 154

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4-Dimethyl, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 155

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Methyl-4-chlor, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 156

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Fluor-4-methyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 157

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Dimethyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 158

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,4,6-Trimethyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 159

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-cyano, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 160

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 161

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 162

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Methoxy, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 163

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n 2-Chlor,4-Methyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 164

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Chlor,4-methoxycarbonyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 165

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Chlor,4-Brom, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 166

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Chlor,4-Cyan, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 167

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,6-Difluor,4-methoxy, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 168

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,3-methyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 169

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,5-Dimethyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 170

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-cyan, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 171

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-brom, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 172

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,5-fluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 173

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-methoxy, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 174

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Methyl,4-methoxycarbonyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 175

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2,5-Dimethyl,4-brom, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 176

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-brom, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 177

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,4-methoxy, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 178

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n-2-Fluor,5-methyl, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

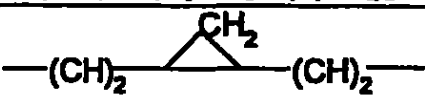
Tabelle 179
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L_n Pentafluor, R³ Cyano bedeuten und R¹, R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle A

No	R ¹	R ²
A-1	CH ₂ CH ₃	H
A-2	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-5	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-8	CH ₂ CH ₂ F	H
A-9	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃
A-10	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₃
A-11	CH ₂ CF ₃	H
A-12	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-13	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CCl ₃	H
A-16	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-17	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-18	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-19	CH(CH ₃) ₂	H
A-20	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-21	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-22	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H
A-24	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-25	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-26	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A-27	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-28	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-30	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃

A-31	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-33	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-34	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-35	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-36	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-37	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-38	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-39	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-40	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-43	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-45	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-47	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-48	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-49	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-52	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-54	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-56	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-57	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-58	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-61	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-63	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-66	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-67	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H

A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-70	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-71	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-72	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-73	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-74	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-77	Cyclopentyl	H
A-78	Cyclopentyl	CH ₃
A-79	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-80	-(CH ₂) ₄ -	
A-81	(±) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-82	(R) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-83	(S) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-84	-(CH ₂) ₂ -CH(OCH ₃)-CH ₂ -	
A-85	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₂ CH ₃)-CH ₂ -	
A-86	-(CH ₂) ₂ -CH[CH(CH ₃) ₂]-CH ₂ -	
A-87	(±) -(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃)-	
A-88	(±) -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-89	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	
A-90	-(CH ₂) ₅ -	
A-91	(±) -(CH ₂) ₄ -CH(CH ₃)-	
A-92	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-93	(±) -(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-94	(R) -(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-95	(S) -(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-96	-(CH ₂) ₂ -C(O[CH ₂) ₂ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-97	-(CH ₂) ₂ -C(O[CH ₂) ₃ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-98		
A-99	-(CH ₂) ₂ -CH=CH-CH ₂ -	

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-
 5 sepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten.

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- 10 • *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- 15 • *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 20 • *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 25 • *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen

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

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

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

- 5 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.

10

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

15

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.

20

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

25

- 30 - Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- 35 - 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.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Ligninsulfatablaugen und Methylcellulose in Betracht

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

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

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

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

Beispiele für Formulierungen sind 1 Produkte zur Verdünnung in Wasser

A) Wasserlösliche Konzentrate (SL)

- 5 10 Gew -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff

B) Dispergierbare Konzentrate (DC)

10

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

15 C) Emulgierbare Konzentrate (EC)

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

20

D) Emulsionen (EW, EO)

- 25 40 Gew -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion

E) Suspensionen (SC, OD)

30

20 Gew -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs

35

F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

- 40 50 Gew -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate

hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G) Wasserdispersierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

5

75 Gew -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispersier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

10

2 Produkte für die Direktapplikation

H) Stäube (DP)

15 5 Gew Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I) Granulate (GR, FG, GG, MG)

20 0,5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95,5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

25 J) ULV- Lösungen (UL)

10 Gew -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

30

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

35

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden.

40

den Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventu-
5 tuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfähigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und
10 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.

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

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

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

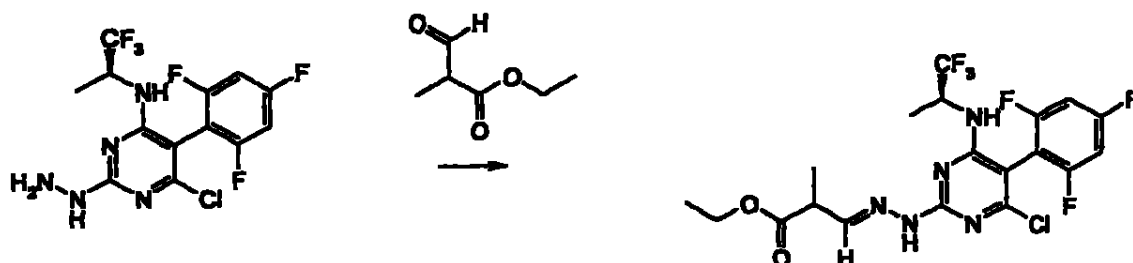
- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Amindervate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin,
35 Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tndemorph
- Anilinopyrimidine wie Pymethanil, Mepanipynm oder Cyprodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,

- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Tritconazol,
- 5 • Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metram, Propneb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon,
- 10 • Fenanmol, Fubendazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuanmol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Trifonne,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- 15 • Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Fenmzone,
- 20 • Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Tolclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Oryastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 25 • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph

Synthesebeispiele

Synthese der Hydrazid-Zwischenprodukte

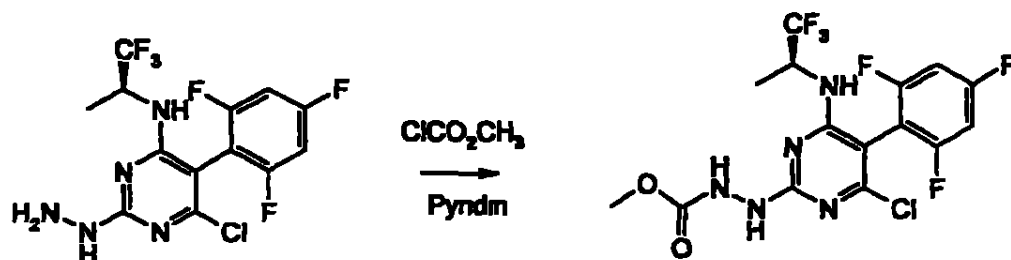
5 Beispiel 1



- 1 9 g (5 mmol) des Hydrazids wurden in 40 ml Diethylether vorgelegt. Dann gab man 0 8 g (5 5 mmol) des Aldehyds zu und rührte über Nacht bei Raumtemperatur nach Reaktionskontrolle erfolgte über DC Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wurde das Produkt säulenchromatographisch gereinigt (DCM) Man erhielt das Produkt als beigefarbene Kristalle Ausbeute 64%
- ¹H-NMR (CDCl₃) = 1 2-1 3 (bm, 6 H), 1 4 (d, 3 H), 3 4 (m, 1 H), 4 2 (q, 2 H), 4 25 (d, 1 H, NH), 6 8 (m, 2 H), 7 3 (d, 1 H), 8 2 (bs, 1 H)

15

Beispiel 2

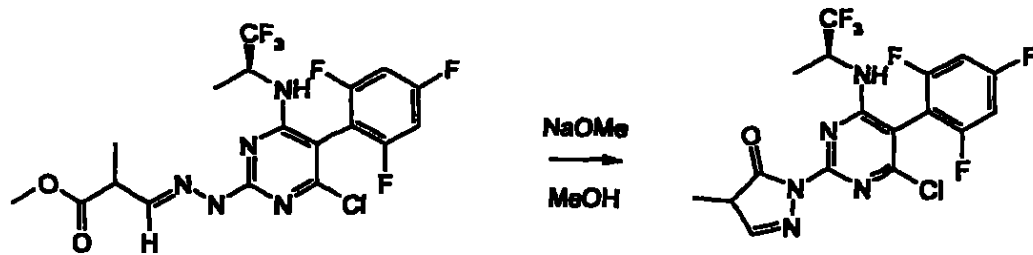


- 20 1 0 g (2 6 mmol) des Hydrazids wurden in 1 ml absolutem Pyridin gelöst. Dann gab man 0 25 g (2 6 mmol) Methylchloroformiat und 5 ml Wasser zu Es wurde über Nacht nachgerührt Reaktionskontrolle erfolgte über HPLC Zur Aufarbeitung wurde der Feststoff abgesaugt und nacheinander mit 1 5 ml dest. Wasser, zweimal mit 10%iger Essigsäure und abschließend dreimal mit Wasser gewaschen Nach dem Trocknen erhielt man 0 9 g des Produktes (75% Ausbeute)

25

Wirkstoffbeispiele

Beispiel 3



5

1,4 g (3 mmol) des Hydrazons (Beispiel 1) wurden in 10 ml abs. Methanol gelöst. Nach Zugabe von 0,6 g (3 mmol) Natriummethylat-Lösung (30% in Methanol) wurde über Nacht bei Raumtemperatur nachgerührt. Reaktionskontrolle erfolgte über HPLC. Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wurde das Reaktionsgemisch mit dest. Wasser verrührt und mit 5% Salzsäure auf pH 1-2 eingestellt. Es wurde dreimal mit DCM extrahiert und einmal mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung nachgewaschen. Die vereinigten Extrakte wurden getrocknet und eingedunstet. Der Rückstand wurde mit Diisopropylether digeriert, abgesaugt, mit Diisopropylether und n-Pentan gewaschen und getrocknet. Das Produkt fiel als farbloser Feststoff an. Ausbeute 0,7 g

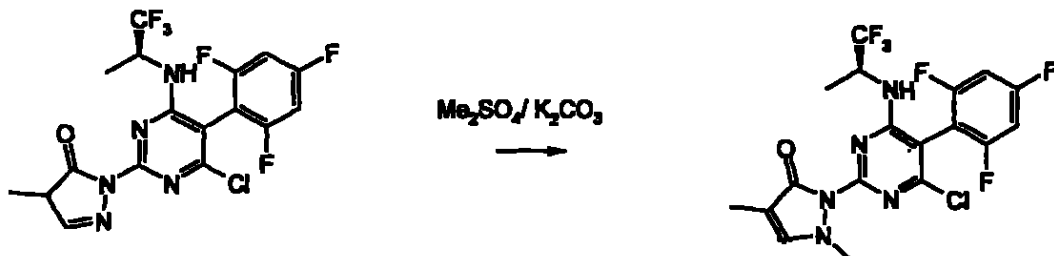
10

15

(55%)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) ppm = 1,1 (d, 3 H), 1,4 (d, 3 H), 2,0 (s, 3 H), 4,9 (d, 1 H), 5,2 (m, 1 H), 6,9 (m, 2 H), 7,4 (d, 1 H)

Beispiel 4



20

0,25 g des Pyrimidins (Beispiel 3) wurden in 5 ml Methanol gelöst und 0,15 g (1,2 mmol) Dimethylsulfat und 0,14 g (1 mmol) Kaliumcarbonat zugegeben. Man rührte drei Stunden bei RT. Nach Reaktionskontrolle erfolgte über HPLC. Es wurde nochmals Dimethylsulfat (0,15 g, 1,2 mmol) zugegeben, so dass der Umsatz vollständig war. Zum Zerstören überschüssigen Dimethylsulfats wurde mit 10%iger wässriger Ammoniaklösung und Dichlormethan (DCM) gerührt. Nach der Phasentrennung wurde die wässrige Phase mit DCM extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen und dann getrocknet. Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im Rotations-

25

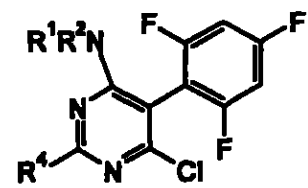
onsverdampfer wurde das Produkt säulenchromatographisch gereinigt (Toluol Essig-
ester 9 1, 7 3) Ausbeute 100 mg (38%)
¹H-NMR (CDCl₃) ppm = 1 25 (d, 3 H), 1 8 (s, 3 H), 3 2 (s, 3 H), 5 0 (m, 1 H), 5 1 (m, 1
H), 6 8 (m, 2 H), 7 0 (m, 1 H)

5

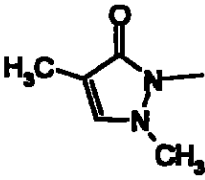
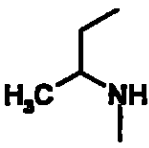
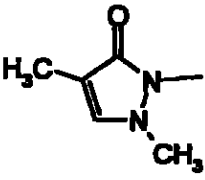
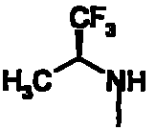
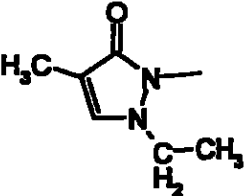
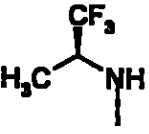
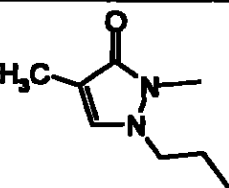
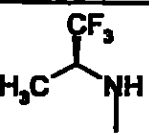
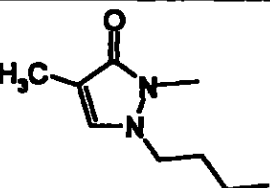
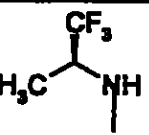
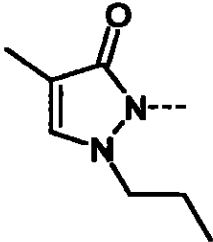
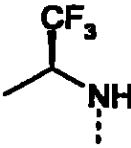
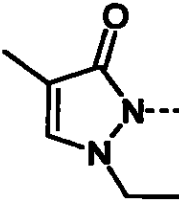
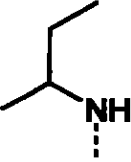
Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden
unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer
Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden
Tabelle A mit physikalischen Angaben aufgeführt

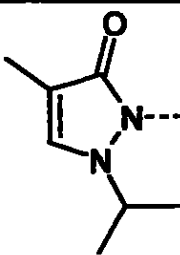
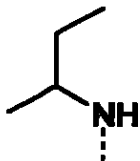
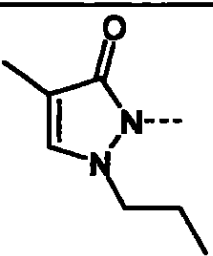
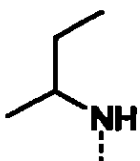
10

Tabelle B



Nr	R ⁴	NR ¹ R ²	Phys Konstanten Fp [°C]
I-01			Öl
I-02			187-189
I-03			217-218
I-04			Öl

Nr	R ⁴	NR ¹ R ²	Phys Konstanten Fp [°C]
I-05			215-217
I-06			194-196
I-07			207-211
I-08			200-204
I-09			Öl
I-10			Öl
I-11			155-157

Nr	R ⁴	NR ¹ R ²	Phys Konstanten Fp [°C]
I- 12			Öl
I- 13			179-183

Beispiele für die Wirkung gegen Schädlinge

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

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als eine Stammlösung aufbereitet mit
0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emul-
gator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis e-
thoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration
10 mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiele

15 1 Wirksamkeit gegen die Dürfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani* bei protektiver Anwendung

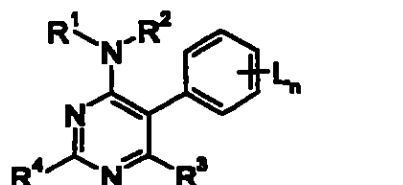
Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer
wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropf-
nässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen
20 Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von
0,17 x 10⁶ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-
gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen

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

- Die mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen behandelten Pflanzen zeigten einen deutlich
- 5 geringeren Befall als die unbehandelten Pflanzen

Patentansprüche

1 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I



5

in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben

- n eine ganze Zahl von 1 bis 5, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt,
- 10 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), Nitro, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A oder S(=O)_m-N(A')A,
- 15 m 0, 1 oder 2,
- A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können, oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome
- 20 aus der Gruppe O, N oder S, stehen,

25

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R^u tragen können

30

35

R^u Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkoxy, C₃-C₈-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A oder S(=O)_m-N(A')A, wobei m, A, A', A'' die vorgenannte Bedeutung haben und wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder voll-

ständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^v tragen können, wobei R^v die gleiche Bedeutung wie R^u besitzt;

5 R^1, R^2 unabhängig voneinander C_1-C_8 -Alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_2-C_8 -Alkenyl, C_2-C_8 -Alkynyl, C_1-C_8 -Halogenalkyl, C_3-C_8 -Halogencycloalkyl, C_2-C_8 -Halogenalkenyl oder C_2-C_8 -Halogenalkynyl,

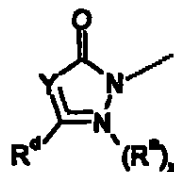
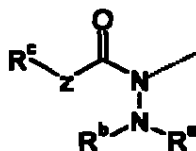
R^2 kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten,

10 R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether-(-O-), Carbonyl -C(=O)-, Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S(=O)-) oder Sulfanyl-(-SO₂-) Gruppe unterbrochen sein kann,

15 R^3 Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, C_2-C_4 -Alkenyl, C_2-C_4 -Alkynyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_3-C_4 -Alkenyloxy oder C_3-C_4 -Alkynyloxy, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von R^3 durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_2 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxy-carbonyl substituiert sein können,

20

R^4 einer der Formeln



25 entspricht, wobei

x 0 oder 1 bedeutet;

30 R^a, R^b und R^c unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_8 -Alkenyl, C_2-C_8 -Alkynyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_4-C_8 -Cycloalkenyl,

R^a, R^b zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, die Bedeutung $R^c-Z-C(R^d)=N$ haben können,

35 Z Sauerstoff oder N- R^c bedeutet;

Y C(H)- R^c , C- R^c , N-N(H)- R^c oder N- R^c bedeutet,

— eine Doppel oder Einfachbindung bedeuten kann,

40

R^d , R^e die gleiche Bedeutungen wie R^a haben und zusätzlich Halogen oder Cyano bedeuten können,

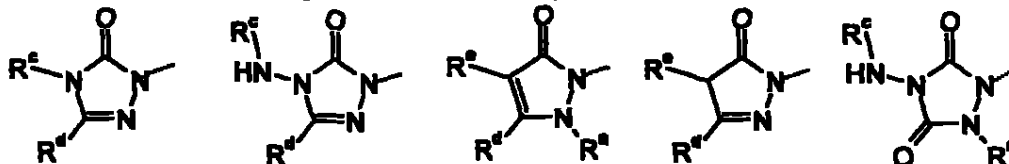
R^d zusammen mit dem Kohlenstoff an das es gebunden ist, eine Carbonylgruppe bedeuten kann,

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^a , R^b , R^c , R^d oder R^e ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R^w tragen können

R^w Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkynyloxy, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkoxy, C_3 - C_8 -Cycloalkenyloxy, und wobei zwei der Reste R^a , R^b oder R^c zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, bilden können

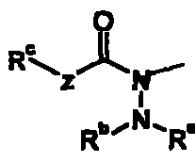
2 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei R^3 Chlor, Cyano, Methyl, Ethyl oder Brom bedeutet.

3 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei R^4 eine der Formeln



bedeutet.

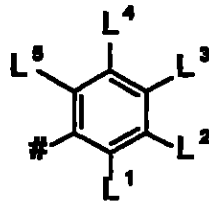
4 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei R^4 der Formel



entspricht

- 5 2-Substituierte Pyrimidine nach einem der Ansprüche 1 bis 6, in der die durch L_n substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B

5



B

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

10

L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ,

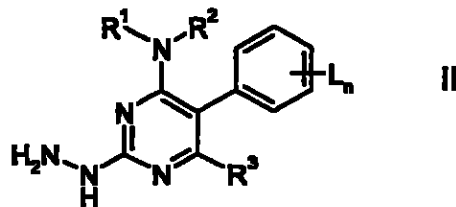
L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, CH_3 oder Fluor;

L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ oder $COOCH_3$ und

15

L^5 Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH_3 bedeuten

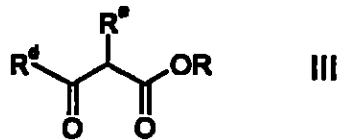
- 6 Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 3, wobei R^4 für ein Pyrazolon steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,



II

20

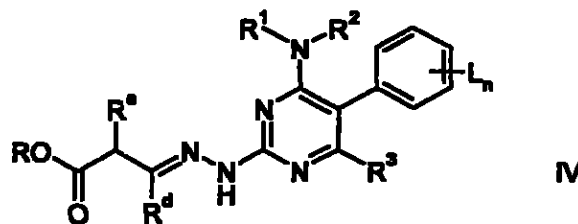
in der die Substituenten L , R^1 , R^2 und R^3 die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben mit einer 1,3-Dicarbonylverbindung der Formel III



III

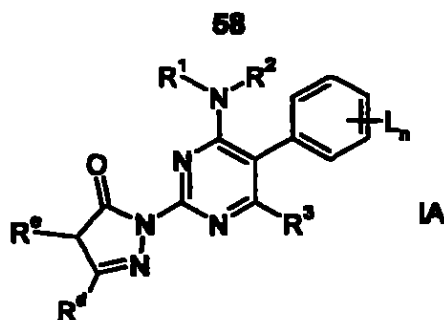
25

in der R^d und R^e die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und R für einen C_1-C_8 -Alkylrest steht, kondensiert und anschließend die erhaltene Verbindung IV

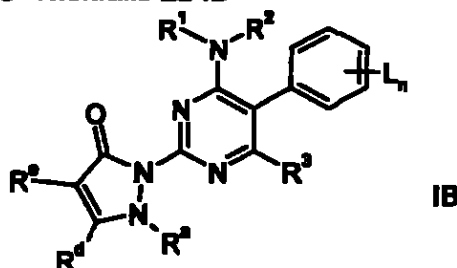


IV

mit einer Base zu IA



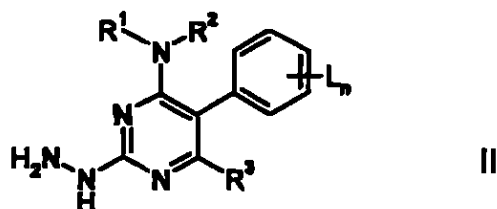
ringeschließt und gegebenenfalls zu IB



isomerisiert.

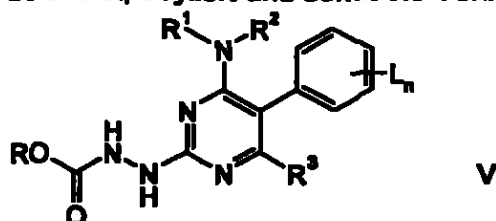
5

- 7 Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 3, wobei R⁴ für ein Triazolidion steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,

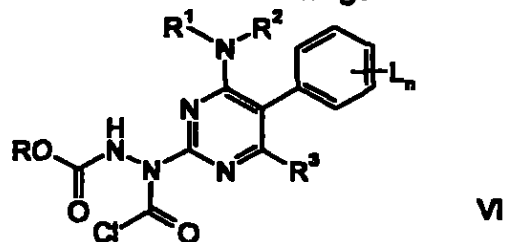


10

in der die Substituenten L, R¹, R² und R³ die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben mit einem Chlorameisensäureester der Formel ClCO₂R, wobei der Substituent R C₁-C₆-Alkyl bedeutet, acyliert und somit die Verbindung V erhält,

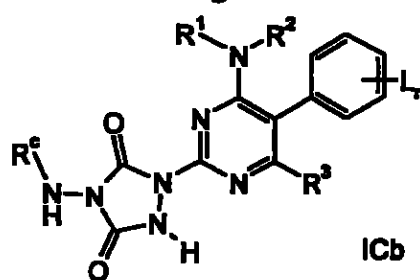
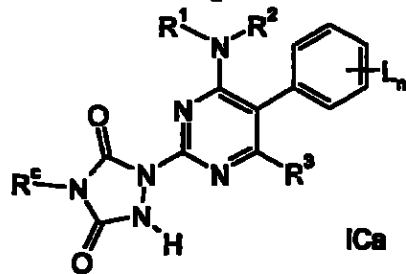


Verbindung V anschließend mit einem Phosgenderivat zu VI umsetzt,



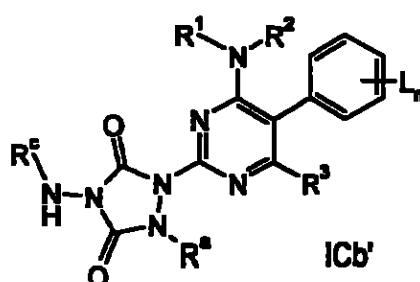
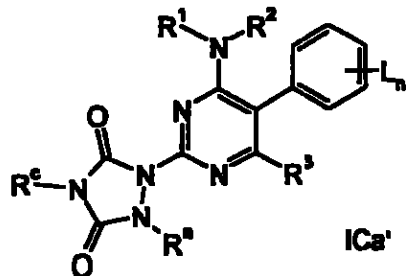
15

VI weiterhin mit einem Amin der Formel R^eNH_2 bzw. mit einem Hydrazin der Formel R^eNH-NH_2 zu den Verbindungen ICa bzw. ICb ringschließt und



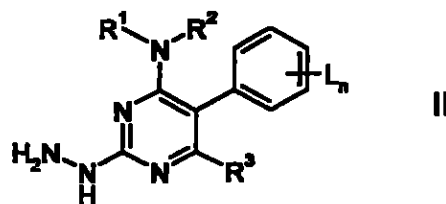
5

gegebenenfalls mit einem Alkylierungsmittel der Formel R^aX , wobei R^a die zuvor genannte Bedeutung besitzt und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid oder Sulfat steht zu ICa' bzw. zu ICb'



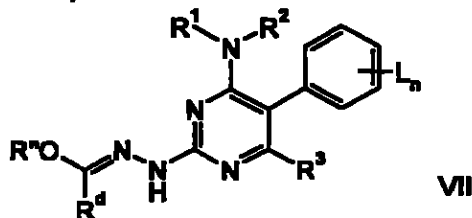
weiter umgesetzt.

- 10 8 Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 3, wobei R^4 für ein Triazoldion steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,



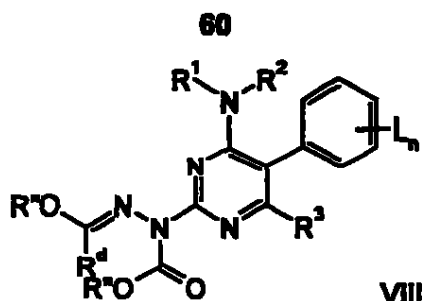
15

in der die Substituenten L, R^1 , R^2 und R^3 die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben mit einem Orthoester der Formel $R^dC(OR'')_3$, wobei der Substituent R^d die zuvor genannte Bedeutung und R'' C_1-C_8 -Alkyl bedeuten, kondensiert und somit die Verbindung VII erhält;

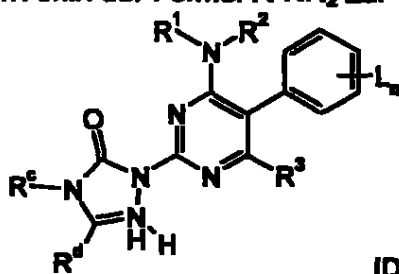


20

Verbindung VII anschließend mit einem Chlorameisensäureester der Formel $ClCO_2R''$, wobei der Substituent R'' C_1-C_8 -Alkyl bedeutet, zu Verbindung VIII acyliert,

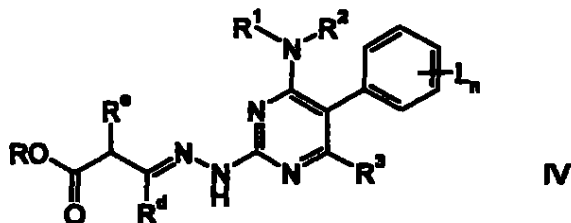


VIII weiterhin mit einem Amin der Formel R^5NH_2 zur Verbindung ID



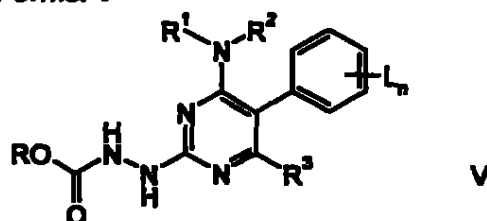
5 ringschließt.

9 Verbindungen der Formel IV



10 wobei die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 , L_n , R^6 und R^4 die in Anspruch 1 angegeben Bedeutung haben und der Substituent R für einen C_1 - C_6 -Alkylrest steht.

10 Verbindungen der Formel V



15 wobei die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und L_n die in Anspruch 1 angegeben Bedeutung haben und der Substituent R für einen C_1 - C_6 -Alkylrest steht.

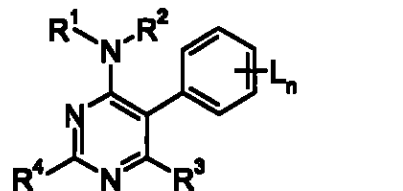
11 Zur Bekämpfung von Schädlingen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1

20 12 Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schädlingen, 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.

Pinmidinas 2-sustituidas

Descripción

- 5 La presente invención se refiere a pinmidinas de la fórmula I,



en la que el índice y los sustituyentes tienen los significados siguientes

- 10 n es un número entero de 1 a 5, encontrándose por lo menos un sustituyente L en la posición orto en el anillo fenilo,

L significa halógeno, ciano, cianato (OCN) nitro, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₁-C₈-alcoxi, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A,

15

m es 0, 1 ó 2,

- 20 A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, fenilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o completamente halogenados o estar sustituidos por ciano o C₁-C₄-alcoxi, o pudiendo A y

A' formar junto con los átomos, a los que están ligados, un heterociclo saturado, parcialmente no saturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

5 pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos de las definiciones de los radicales de L a su vez estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u

10 R^u significa halógeno, ciano, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₁-C₈-alcoxi, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-cicloalcoxi, C₃-C₈-cicloalquenilo, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A, teniendo m, A A', A'' los significados antes indicados y pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos a su vez estar parcial o completamente halogenados llevar uno a tres grupos R^v, donde R^v tiene el mismo significado que R^u,

15

20 R¹, R² significan, independientemente, C₁-C₈-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo o C₂-C₈-halógenoalquinilo,

R² puede significar, adicionalmente, hidrógeno,

25

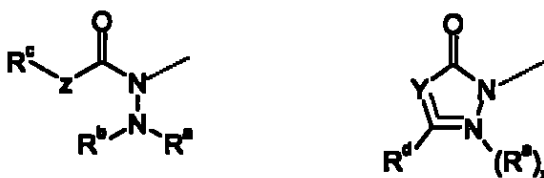
R^1 y R^2 también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo saturado o no saturado con cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter ($-O-$), carbonilo $C(=O)$, tio- $(-S-)$, sulfoxilo $(-S(=O)-)$ o sulfonilo- $(-SO_2-)$,

5

R^3 significa halógeno, clano, C_1-C_4 -alquilo, C_2-C_4 -alquenilo, C_2-C_4 -alquinilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_3-C_4 -alquenilo o C_3-C_4 -alquinilo, pudiendo los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo de R^3 estar sustituidos por halógeno, clano, nitro, C_1-C_2 -alcoxi o C_1-C_4 -alcoxycarbonilo,

10

R^4 corresponde a una de las fórmulas



15

donde

x es 0 ó 1,

20

R^8 , R^b y R^c significan, independientemente, hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_4-C_6 -cicloalquenilo,

R^a , R^b pueden significar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, $R^c-Z-C(R^d)=N$,

Z es oxígeno o N-R^c,

Y significa C(H)-R^a, C-R^a, N-N(H)-R^c o N-R^c,

5 — representa un doble o simple enlace,

R^d, R^e tienen los mismos significados que R^c y significan, adicionalmente, halógeno o ciano,

10 R^d puede significar junto con el átomo de carbono, al que está ligado un grupo carbonilo,

pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos de las definiciones de los radicales de R^a, R^b, R^c, R^d o R^e a su vez estar parcial o completamente

15 halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^w

R^w significa halógeno, ciano, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₁-C₈-alcoxi, C₂-C₁₀-alqueniloxi, C₂-C₁₀-alquiniloxi, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-cicloalcoxi, C₃-C₈-

20 cicloalqueniloxi, y pudiendo dos de los radicales R^a, R^b o R^c formar junto con los átomos, a los que están ligados, un heterociclo saturado, parcialmente no saturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S

Además, la invención se refiere a un procedimiento para la obtención de estos compuestos, a productos que contienen estos compuestos, así como al uso de los mismos para combatir hongos fitopatógenos

- 5 De la WO-A 01/96314 se conocen pirimidinas fungicidas, que en la posición 2 llevan un sustituyente cianamino. Además, se conocen de la WO 02/74753 pirimidinas fungicidas, que en la posición 2 llevan, generalmente, un radical heterocíclico. Pero solo se mencionan específicamente las pirimidinas sustituidas por heteroanillo.
- 10 Sin embargo, el efecto de las pirimidinas arriba indicadas es insatisfactorio en muchos casos. Por tanto, el objeto era hallar compuestos con eficiencia mejorada.

Se encontraron, ahora, las pirimidinas arriba definidas de la fórmula I. Además, se encontró un procedimiento para su obtención, así como productos que los contienen

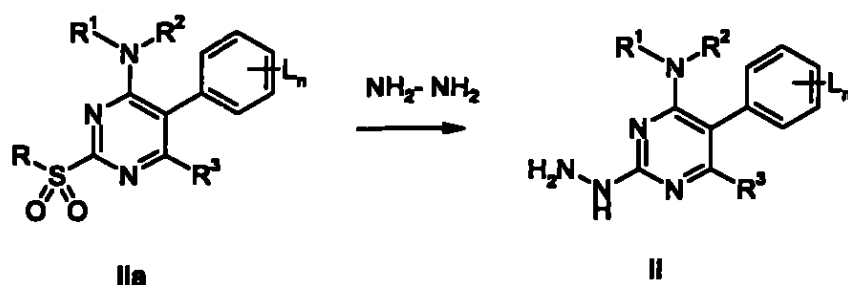
- 15 para combatir hongos nocivos.

Los compuestos I se pueden preparar mediante diferentes métodos.

- 1) Por ejemplo, se puede partir de hidracinopirimidinas de la fórmula II, cuya
- 20 preparación está descrita en detalle en la WO-A 02/074753 o la DE 10156279 9.
- En lo sucesivo se ilustra una preparación preferida de los compuestos II partiendo de sulfonas IIa.

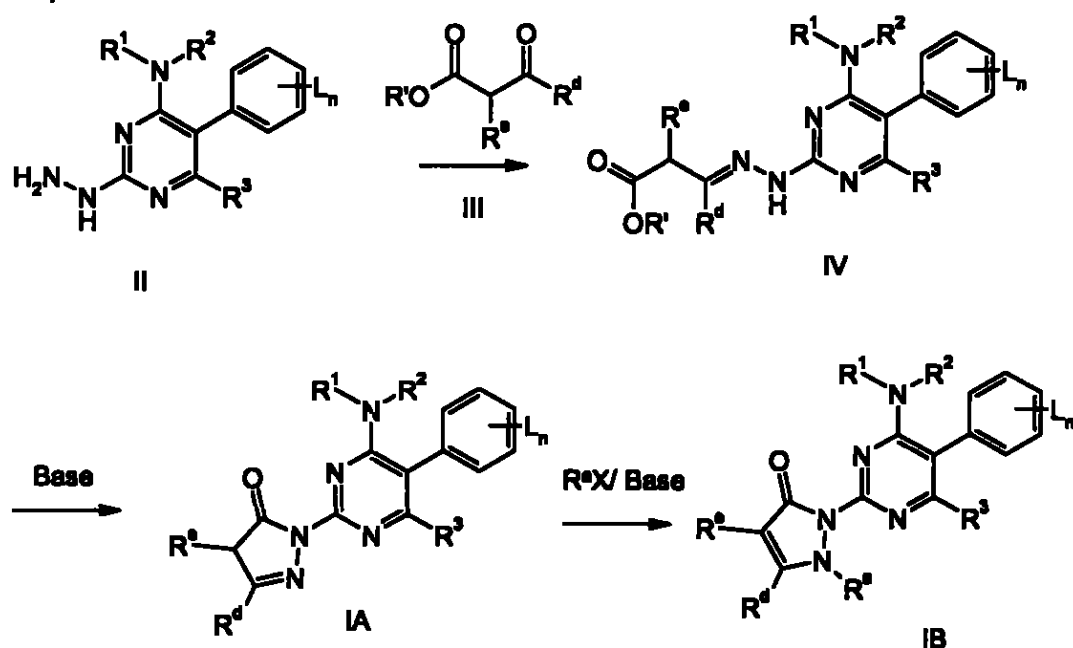
PF 54547

6



La síntesis subsiguiente puede llevarse a cabo en la forma representada en el esquema 1

5 Esquema 1



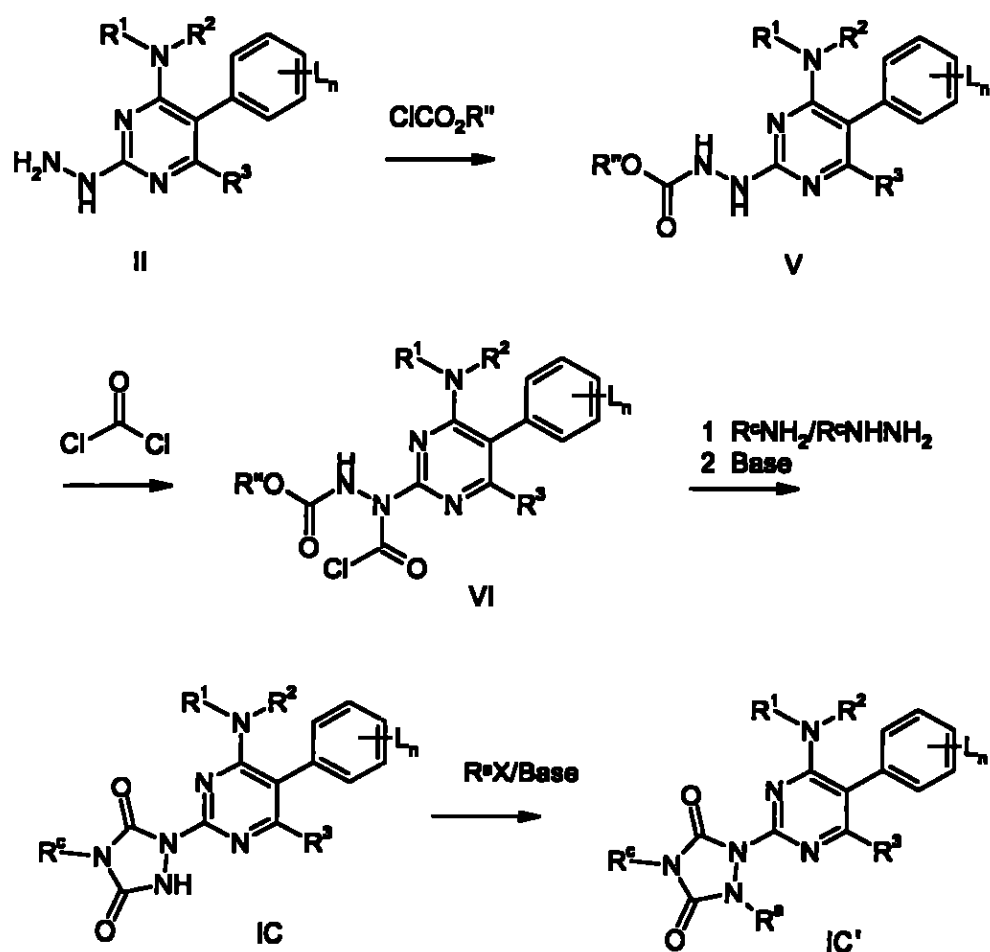
El compuesto de hidracina II es condensado con un compuesto de dicarbonilo III, donde los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 , L_n , R^d y R^e tienen los significados arriba indicados y

- 10 R^e representa un grupo alquilo, arilo o bencilo (ver el Esquema 1), obteniéndose los compuestos de la fórmula VI. Los compuestos de dicarbonilo de la fórmula III se conocen de *Angew Chem Int Ed Engl* 1989 28, p. 500. La condensación se efectúa en la forma descrita en la DE 19627002. La ciclización dando los compuestos según la invención IA se realiza, por ejemplo, en presencia de bases, tales como,

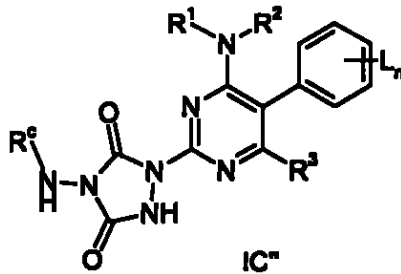
especialmente, alcoxiatos de metal alcalino. Se describe explícitamente la reacción con metilato sódico (*Synlett* 1996, 667-8). En presencia de agentes de alquilación R^aX , donde R^a tiene el significado arriba indicado y X representa un grupo disociable, tales como un haluro o sulfato, y una base fuerte, por ejemplo hidruro sódico o carbonato de potasio anhidro, se obtienen los compuestos según la invención IB

2) El procedimiento de preparación representado en el Esquema 2 proporciona los compuestos según la invención IC

10 Esquema 2



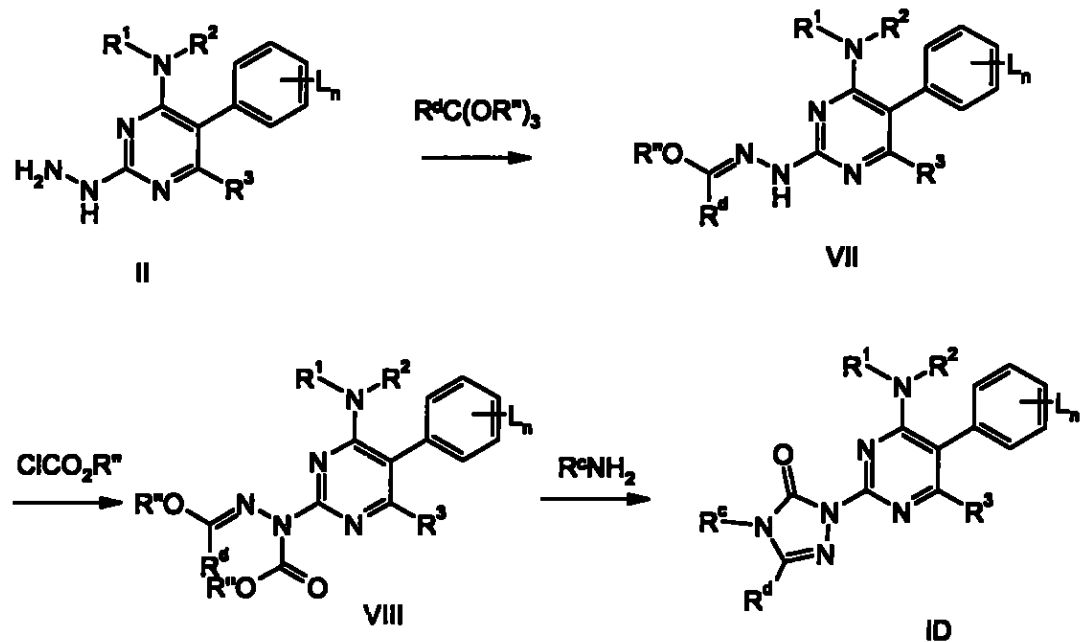
La sustancia de partida para la síntesis de los compuestos IC y IC' es, preferentemente, el compuesto de hidracina II, cuya obtención ya se ha descrito en detalle más arriba. La transformación con cloroformiato (R'' representa un radical alquilo) en los compuestos acilados V se realiza generalmente, en presencia de una base. La transformación ulterior de V con fosgeno o bien un equivalente de fosgeno dando VI y la subsiguiente ciclización en presencia de una amina/hidracina y una base, se puede efectuar en analogía al método descrito en *Chem Ber* 1898, 31, páginas 2320 y sig. La ciclización en presencia de aminas R^cNH_2 proporciona las triazolidindionas IC, mientras que la ciclización en presencia de hidracinas R^cNH-NH_2 proporciona los compuestos IC''.



La alquilación de los compuestos IC con agentes de alquilación R^aX , donde R^a tiene el significado arriba indicado y X representa un grupo disociable, como p.ej. un haluro o sulfato, en presencia de una base, se efectúa según la DE 3336693.

3) triazolidinonas del tipo ID se pueden preparar, ventajosamente, en la forma representada en el Esquema 3

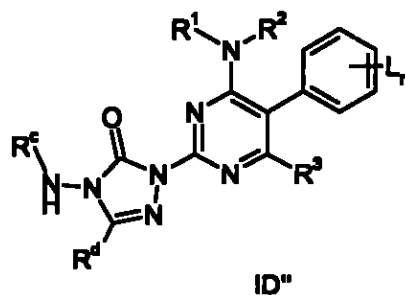
Esquema 3



Partiendo de los compuestos de hidracina II y ortoésteres se obtiene el compuesto condensado VII análogamente al método descrito en *J Am Chem Soc.* 1995, **77**,

- 5 p 1148 VII es aclado subsiguientemente con cloroformiato dando VIII en analogía al método descrito en *Compt Rend Acad Sci* 1981, **293**, N8, 573-76 R'' en el ortoéter y el cloroformiato representa C₁-C₆-alquilo La ciclización en los compuestos según la invención ID tiene lugar en presencia de aminas R^eNH₂ Si en lugar de aminas se usan hidracinas de la fórmula R^eNH-NH₂, entonces se obtienen las tiazolidinonas de la

10 fórmula ID''

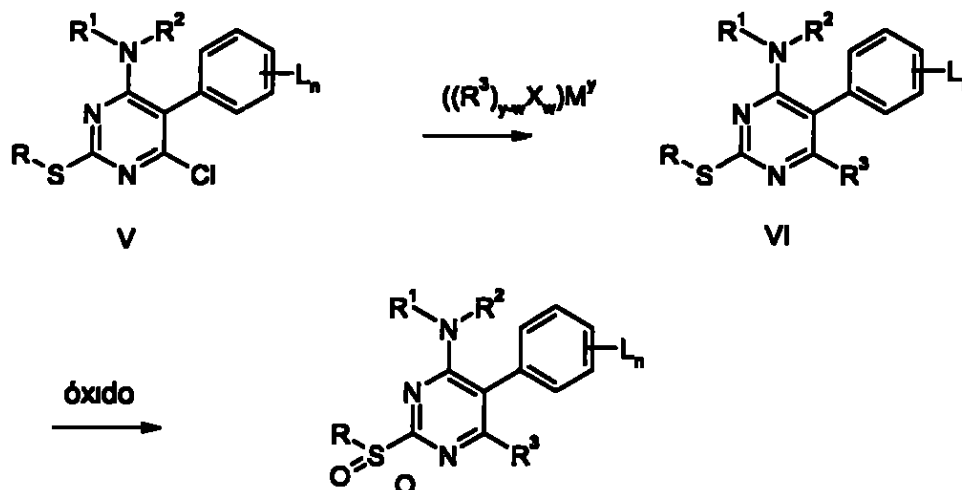


El radical R³ (especialmente, alquilo) en la posición 6 en el anillo pirimidina puede ser introducido por reacción bajo catálisis de un metal transitorio, como p ej Ni o Pd en

algunos casos puede ser recomendable invertir el orden e introducir el sustituyente R^3 anteriormente al sustituyente NR^1R^2

Esquema 4

5



En la fórmula $(R^3)_wX_w-M^y$ representa M un ión de metal de la valencia Y, por ejemplo,

- 10 B, Zn, Mg, Cu o Sn, X representa cloro, bromo, yodo o hidroxilo, R^3 representa, preferentemente, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y w es un número entero de 0 a 3. Esta reacción puede ser efectuada, por ejemplo, en analogía a los métodos siguientes: J Chem Soc. Perkin Trans 1, 1187 (1994), loc. cit 1, 2345 (1996), WO-A 99/41255, Aust J Chem, Vol 43, 733 (1990), J Org Chem, Vol 43, 358 (1978), J
- 15 Chem Soc Chem Commun 866 (1979), Tetrahedron Lett., Vol 34, 8267 (1993), loc cit, Vol 33, 413 (1992)

Las indicaciones arriba dadas se refieren, especialmente, a la preparación de compuestos, en los que R^3 representa un grupo alquilo. Cuando R^3 representa un

grupo ciano o un sustituyente alcoxi, el radical R^3 puede ser introducido con cianuros de metal alcalino o bien alcoholatos de metal alcalino

- 5 En las definiciones de los símbolos indicados en las fórmula se han usado términos colectivos, que son generalmente representativos de los siguientes sustituyentes

halógeno flúor, cloro, bromo e yodo,

- 10 **alquilo** hidrocarburos saturados, lineales o ramificados con 1 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono, por ejemplo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, como p ej metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-
- 15 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,

halógenoalquilo grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 10 átomos de carbono

- 20 (como los arriba mencionados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar sustituidos por átomos de halógeno como los arriba mencionados, p ej C_1-C_2 halógenoalquil wie clorometilo, bromometilo, diclorometilo, trclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo,

2-cloro-2-fluoroetil, 2-cloro-2,2-difluoroetil, 2,2-dicloro-2-fluoroetil, 2,2,2-tricloroetil, pentafluoroetil ó 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo,

- alquenilo** radicales hidrocarburo insaturados, lineales o ramificados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria, p ej C_2-C_6 -alquenil como p ej etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metilethenilo, 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-1propenilo, 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-1propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo,

- alcadlenilo** radicales hidrocarburo insaturados, lineales o ramificados con 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y dos dobles enlaces en una posición arbitraria,

halógenoalqueno radicales hidrocarburo insaturados, lineales o ramificados con 2 a 10 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria (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, flúor, cloro y bromo,

alquino grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y un triple enlace en una posición arbitraria, p ej alquino C_2-C_{10} , como p ej etino, 1-propino, 2-propino, 1-butino, 2-butino, 3-butino, 1-metil-2-propino, 1-pentino, 2-pentino, 3-pentino, 4-pentino, 1-metil-2-butino, 1-metil-3-butino, 2-metil-3-butino, 3-metil-1-butino, 1,1-dimetil-2-propino, 1-etil-2-propino, 1-hexino, 2-hexino, 3-hexino, 4-hexino, 5-hexino, 1-metil-2-pentino, 1-metil-3-pentino, 1-metil-4-pentino, 2-metil-3-pentino, 2-metil-4-pentino, 3-metil-1-pentino, 3-metil-4-pentino, 4-metil-1-pentino, 4-metil-2-pentino, 1,1-dimetil-2-butino, 1,1-dimetil-3-butino, 1,2-dimetil-3-butino, 2,2-dimetil-3-butino, 3,3-dimetil-1-butino, 1-etil-2-butino, 1-etil-3-butino, 2-etil-3-butino y 1-etil-1-metil-2-propino,

cicloalquilo grupos hidrocarburo mono o bicíclicos, saturados con 3 a 6 miembros anulares de carbono, p ej cicloalquilo C_3-C_6 , como p ej ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo,

heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S

1
2
3

- **heterociclillo de cinco o seis miembros, que contiene uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, p ej 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-pipendinilo,**

3-pipendinilo, 4-pipendinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropindacinilo, 4-hexahidropindacinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperacinilo, 1,3,5-hexahidro-triacin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiacin-3-ilo,

- **heteroarillo de cinco miembros**, que contiene uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno grupos heteroarillo pentacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros del anillo, p ej 2-funilo, 3-funilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo,

- **heteroarillo de seis miembros**, que contiene uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno grupos heteroarillo hexacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros del anillo, p ej 2-pindinilo, 3-pindinilo, 4-piridinilo, 3-pindacinilo, 4-piridacinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-piracínilo, 1,3,5-triacin-2-ilo y 1,2,4-triacin-3-ilo,

En el ámbito de la presente invención están comprendidos los isómeros (R) y (S) y los racematos ($\pm$) de los compuestos de la fórmula I, que presentan centros de quiralidad

En lo sucesivo se describe la invención en más detalle

5

Con respecto al uso a que están destinadas las pirimidias de la fórmula I, se prefieren los siguientes significados para los sustituyentes, tanto por sí solos como en combinaciones

- 10 Se prefieren los compuestos I, en los que R^1 significa C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -halógenoalquilo, C_2-C_6 -alqueno, C_2-C_6 -alquino o C_3-C_6 -cicloalquilo y R^2 significa hidrógeno

- Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^1 representa C_1-C_6 -alquilo
15 ramificado en la posición α o C_1-C_6 -halógenoalquilo

Además, son preferidos los compuestos I, en los que R^1 representa C_1-C_4 -halógenoalquilo y R^2 es hidrógeno

- 20 Adicionalmente, son preferidos los compuestos I, en los que R^1 y R^2 forman junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un átomo de oxígeno y que puede llevar uno o dos sustituyentes C_1-C_6 -alquilo

Son especialmente preferidos los grupos NR^1R^2 , como por ejemplo pirrolidinas o piperidinas metiladas, especialmente, en la posición α .

Además, son especialmente preferidas las pirimidinas I, donde el índice n y los
5 sustituyentes L^1 a L^5 tienen los significados siguientes

n es 1 a 3,

L es halógeno, ciano, C_1-C_8 -alquilo, C_2-C_{10} -alquenilo, C_2-C_{10} -alquinilo, C_1-C_8 -
alcoxi, C_2-C_{10} -alquenilo, C_2-C_{10} -alquinilo, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_3-C_8 -
10 cicloalquenilo, C_3-C_8 -cicloalcoxi, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$,
 $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$ o $S(=O)_m-A$,

m es 0, 1 ó 2,

15 A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, C_1-C_8 -alquilo, C_2-C_8 -
alquenilo, C_2-C_8 -alquinilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o
completamente halogenados o estar sustituidos por ciano o C_1-C_4 -alcoxi, o
pudiendo A y A' representar junto con los átomos, a los que están ligados, un
heterociclo saturado de cinco o seis, que contiene uno a cuatro heteroátomos
20 del grupo O, N, o S

Son especialmente preferidas las pirimidinas I, donde los sustituyentes L^1 a L^5 tienen
los significados siguientes

L es halógeno, ciano, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-alcoxi, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A,
m es 0, 1 ó 2,

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-
alquenilo, C₂-C₈-alquinilo

5

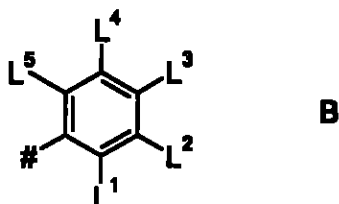
Son especialmente preferidos los compuestos I en los que R^u significa halógeno,
ciano, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₁-C₈-alcoxi, C₂-C₁₀-alqueniloxi,
C₂-C₁₀-alquiniloxi, C₃-C₈-cicloalquilo, C₅-C₈-cicloalquenilo, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A,
C(A')(=N-OA), pudiendo los grupos alifáticos o alicíclicos a su vez estar parcial o

10 completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^v, donde R^v tiene el mismo
significado que R^u

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^u significa halógeno,
ciano, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₁-C₈-alcoxi, C₂-C₈-alqueniloxi,

15 C₂-C₈-alquiniloxi, C₃-C₈-cicloalquilo, C₅-C₈-cicloalquenilo

Además, son preferidas las pirimidinas I, donde el grupo fenilo sustituido por L_n
representa el grupo B



20 donde # representa el lugar de enlace con el esqueleto de pirimidina y

L¹ significa flúor, cloro, CH₃ o CF₃.

L², L⁴ significan, independientemente, hidrógeno, CH₃ o flúor ,

L^3 significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $CO-NH_2$, $CO-NHCH_3$, $CO-NHC_2H_5$, $CO-N(CH_3)_2$, $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ o $COOCH_3$ y

L^5 significa hidrógeno, flúor, cloro o CH_3

5

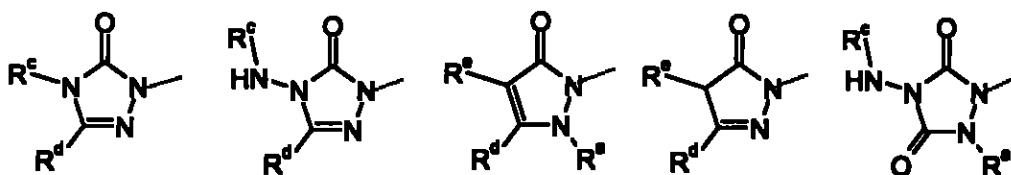
También son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^3 significa C_1-C_4 -alquilo, que puede estar sustituido por halógeno

Además, son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^3 significa

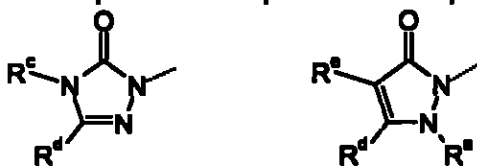
10 halógeno ciano, C_1-C_4 -alquilo o C_1-C_4 -alcoxi

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^3 significa metilo, etilo, ciano, bromo o, sobre todo, cloro

15 Adicionalmente, son preferidas las pirimidinas de la fórmula I en la que R^4 significa

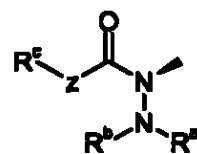


Son especialmente preferidas las pirimidinas de la fórmula I, en la que R^4 significa



20

Son especialmente preferidas las pirimidinas de la fórmula I, en la que R^4 corresponde a la fórmula



Preferentemente, R^a, R^b y R^c significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo o C₃-C₆-cicloalquilo

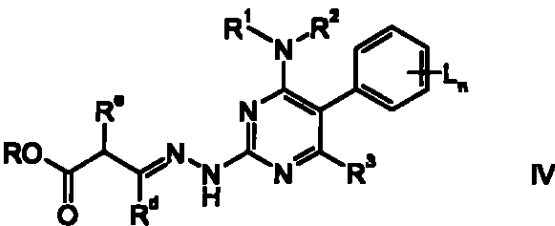
5

Preferentemente, R^a, R^b y R^c significan, independientemente, hidrógeno, metilo o etilo

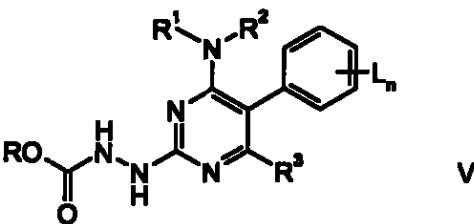
Para los productos intermedios de las fórmulas IV, V, VI y VII valen las mismas preferencias que las antes mencionadas para los principios activos. Aquí los

10 sustituyentes tienen las mismas definiciones prefendas, tanto por si solos como también en combinaciones

Son especialmente prefendos los productos intermedios de las fórmulas IV y V



15

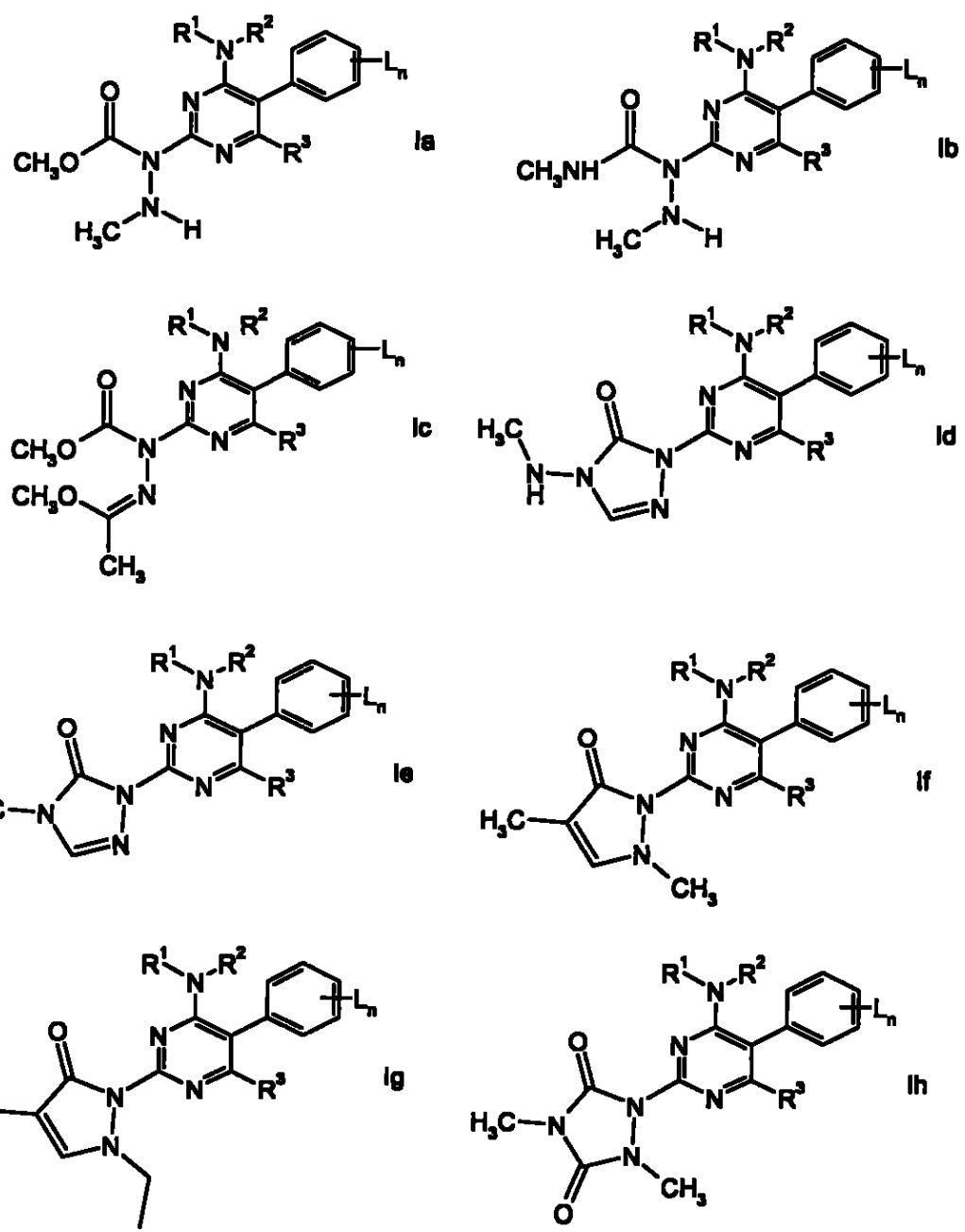


Especialmente, con respecto a su uso se prefieren los compuestos representados en las siguientes Tablas. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente

20 representan, además, considerados por si solos, independientemente de la

28

combinación en que se mencionan, una variante especialmente prefenda del respectivo sustituyente



Compuestos de la fórmula Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que Ln significa 2-fluoro,6-cloro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

Tabla 1

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-
difluoro R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea
de la Tabla A

5

Tabla 2

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-
dicloro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea
de la Tabla A

10

Tabla 3

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-
fluoro 6-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una
línea de la Tabla A

15

Tabla 4

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,6-
trifluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea
de la Tabla A

20

Tabla 5

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-
metilo,4-fluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una
línea de la Tabla A

25



Tabla 6

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxycarbonilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 7

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,4-CN, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 8

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,5-trifluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 9

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-dicloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 10

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 11

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 12

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4-difluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 13

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-cloro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 14

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro-4-fluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 15

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,3-difluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 16

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-difluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 17

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3,4-trifluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 18

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 19

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-dimetilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 20

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metil-4-cloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 21

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 22

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-dimetilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 23

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,6-trimetilo R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 24

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-ciano, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 25

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 26

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 27

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro 4-metoxi, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 28

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 29

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-metoxycarbonilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 30

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

85

Tabla 31

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh en los que L_n significa 2-cloro,4-ciano, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 32

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro,4-metoxi, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 33

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,3-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 34

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-dimetilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 35

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-ciano, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 36

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 37

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,5-fluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 38

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo 4-metoxi, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 39

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxycarbonilo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 40

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-dimetilo,4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 41

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 42

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxi, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 43

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,5-metilo R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 44

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa pentafluoro, R³ significa metilo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 45

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro 6-cloro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 46

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 47

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-dicloro R^3 significa cloro y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 48

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,6-metilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 49

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4,6-trifluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 50

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,4-fluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 51

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxicarbonilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 52

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-CN, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 53

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4,5-trifluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 54

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4-dicloro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 55

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

13

Tabla 56

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 57

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-difluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 58

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-cloro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 59

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro-4-fluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 60

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3-difluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 61

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-difluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 62

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3,4-trifluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 63

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 64

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-dimetilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 65

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metil-4-cloro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 66

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-metilo, R² significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 67

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6- dimetilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 68

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4,6- trimetilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 69

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6- difluoro-4-ciano, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 70

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6- difluoro-4-metilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

	Tabla 71 Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6- difluoro-4-metoxicarbonilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A
5	
	Tabla 72 Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4- metoxi, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A
10	
	Tabla 73 Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4- metilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A
15	
	Tabla 74 Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4- metoxicarbonilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A
20	
	Tabla 75 Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4- bromo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A
25	

Tabla 76

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4-ciano, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 77

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro,4-metoxi, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 78

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,3-metilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 79

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-dimetilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 80

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-ciano, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 81

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-bromo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 82

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,5-fluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 83

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxi, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 84

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxycarbonilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 85

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-dimetilo,4-bromo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 86

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro 4-bromo R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 87

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro 4-metoxi, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 88

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,5-metilo, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 89

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa pentafluoro, R³ significa cloro y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 90

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,6-cloro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 91

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 92

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-dicloro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 93

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,6-metilo, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 94

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,6-trifluoro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 95

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-fluoro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 96

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxicarbonilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 97

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-CN, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 98

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4,5-trifluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 99

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4-dicloro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 100

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 101

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 102

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-difluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 103

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-cloro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 104

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro-4-fluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 105

Compuestos de las fórmulas la lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3-difluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 106

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-difluoro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 107

Compuestos de las fórmulas la lb lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3,4-trifluoro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 108

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 109

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-dimetilo, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 110

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n 2-metil-4-cloro, R^3 significa bromo y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

101

Tabla 111

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-metilo R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 112

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-dimetilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 113

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,4,6-trimetilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 114

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-ciano, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 115

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-metilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 116

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 117

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4-metoxi, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 118

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4-metilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 119

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4-metoxycarbonilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 120

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro,4-bromo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 121

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-ciano, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 122

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro,4-metoxi, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 123

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,3-metilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 124

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,5-dimetilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 125

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,4-ciano, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 126

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,4-bromo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 127

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,5-fluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 128

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxi, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 129

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxicarbonilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 130

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,5-dimetilo,4-bromo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25



Tabla 131

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-bromo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 132

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxi, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 133

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,5-metilo, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 134

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa pentafluoro, R³ significa bromo y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 135

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,6-cloro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 136

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 137

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-dicloro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 138

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,6-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 139

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,6-trifluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 140

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-fluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

1

Tabla 141

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxycarbonilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 142

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro,4-CN, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 143

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,5-trifluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 144

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-dicloro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 145

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25



Tabla 146

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 147

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-difluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 148

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-cloro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 149

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-cloro-4-fluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 150

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3-difluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

~ ~

,

~ ~

Tabla 151

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-difluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 152

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,3,4-trifluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 153

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 154

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4-dimetilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 155

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metil-4-cloro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 156

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-fluoro - 4-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 157

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-dimetilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 158

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,4,6-trimetilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 159

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-ciano, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 160

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25



Tabla 161

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 162

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-metoxi, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 163

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 164

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-metoxycarbonilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 165

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-bromo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 166

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-cloro,4-ciano, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 167

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,6-difluoro,4-metoxi, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 168

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,3-metilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 169

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2,5-dimetilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 170

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-metilo,4-ciano, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 171

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-bromo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 172

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,5-fluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 173

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxi, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 174

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2-metilo,4-metoxycarbonilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 175

Compuestos de las fórmulas la, lb, lc, ld, le, lf, lg y lh, en los que L_n significa 2,5-dimetilo,4-bromo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

Tabla 176

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-bromo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 177

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,4-metoxi, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 178

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa 2-fluoro,5-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 179

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig y Ih, en los que L_n significa pentafluoro, R³ significa ciano y R¹, R² representan un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla A

No	R ¹	R ²
A-1	CH ₂ CH ₃	H
A-2	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H

A-5	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_3
A-6	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-7	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-8	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	H
A-9	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	CH_3
A-10	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$	CH_2CH_3
A-11	CH_2CF_3	H
A-12	CH_2CF_3	CH_3
A-13	CH_2CF_3	CH_2CH_3
A-14	CH_2CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-15	CH_2CCl_3	H
A-16	CH_2CCl_3	CH_3
A-17	CH_2CCl_3	CH_2CH_3
A-18	CH_2CCl_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-19	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-20	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-21	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-22	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-23	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H
A-24	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3
A-25	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_2CH_3
A-26	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-27	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-28	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-29	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	H
A-30	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	CH_3
A-31	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-32	$(R) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	H
A-33	$(R) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	CH_3
A-34	$(R) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-35	$(S) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	H
A-36	$(S) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	CH_3
A-37	$(S) \text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-38	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-39	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-40	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-41	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-42	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-43	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3

A-44	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-45	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-47	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-48	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-49	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-52	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-54	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-56	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-57	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-58	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-61	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-63	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-66	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-67	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-70	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-71	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-72	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-73	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-74	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-77	ciclopentilo	H
A-78	ciclopentilo	CH ₃
A-79	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃
A-80	-(CH ₂) ₄ -	
A-81	(±) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-82	(R) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	

A-83	$(S) -(CH_2)_2CH(CH_3)-CH_2-$
A-84	$-(CH_2)_2CH(OCH_3)-CH_2-$
A-85	$-(CH_2)_2CH(CH_2CH_3)-CH_2-$
A-86	$-(CH_2)_2CH[CH(CH_3)_2]-CH_2-$
A-87	$(\pm) -(CH_2)_3CH(CH_3)-$
A-88	$(\pm) -CH(CH_3)-(CH_2)_2CH(CH_3)-$
A-89	$-CH_2CH=CH-CH_2-$
A-90	$-(CH_2)_5-$
A-91	$(\pm) -(CH_2)_4CH(CH_3)-$
A-92	$-(CH_2)_2CH(CH_3)-(CH_2)_2-$
A-93	$(\pm) -(CH_2)_3CH(CH_3)-CH_2-$
A-94	$(R) -(CH_2)_3CH(CH_3)-CH_2-$
A-95	$(S) -(CH_2)_3CH(CH_3)-CH_2-$
A-96	$-(CH_2)_2C(O[CH_2]_2O)-(CH_2)_2-$
A-97	$-(CH_2)_2C(O[CH_2]_3O)-(CH_2)_2-$
A-98	$-(CH_2)_2 \begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{---} \end{array} (CH_2)_2-$
A-99	$-(CH_2)_2CH=CH-CH_2-$

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

5 *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,

10 algodón, soya, café, caña de azúcar, vid, frutas y plantas de adorno y legumbres, tales como frijoles, tomates y cucurbitáceas, así como en las semillas de estas plantas.

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
- especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
- *Blumeria graminis* (oidio) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- 5 • *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
- especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Plasmopara viticola* en vid,
- 10 • *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales,
- *Pynculana oryzae* en arroz,
- 15 • 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
- especies de *Venturia*-Arten (roña) en manzanas y peras
- 20 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
- Los compuestos I se aplican, tratando los hongos o las plantas, semillas, materiales o
- 25 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

- Los productos fungicidas contienen, generalmente, entre 0,1 y 95, preferentemente, entre 0,5 y 90% en peso de principio activo

Cuando se usan en la protección de plantas, las cantidades de aplicación oscilan según el tipo de efecto deseado de entre 0,01 y 2,0 kg de principio activo por ha

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

En la protección de materiales o de productos almacenados, las cantidades de aplicación varían dependiendo del tipo del campo de aplicación y del efecto deseado

- 15 Cantidades de aplicación usuales en la protección de materiales varían, por ejemplo, de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, de 0,005 g a 1 kg de principio activo por metro cubico del material tratado

- Los compuestos 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

Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, diluyendo el principio activo con disolventes y/o soportes, en caso de desearlo, usando emulsionantes y dispersantes. Como disolventes/sustancias auxiliares son apropiados, substancialmente, para este fin

5

agua, disolventes aromáticos (p ej productos Solvesso, xileno), parafinas (p ej fracciones de petróleo), alcoholes (p ej metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (p ej ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso,

10

ácidos grasos y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,

sustancias soporte, tales como polvos de piedras naturales (p ej caolines, arcillas, talco, tiza) y polvos de piedra sintéticos (p ej ácido silícico altamente disperso, silicatos), emulsionantes, tales como emulsionantes no ionógenos y aniónicos (p ej éteres de polioxetileno-alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo) y dispersantes, tales como lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa

15

20 Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con
25 formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y

formaldehído, éter octilfenílico de polioxetileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tnbutilfenil-poliglicol éter, tnestearilfenil-poliglicol éter poliéter alcoholes de alquillarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquilicos de polioxetileno, 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

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 contienen entre 0,01 y 95% en peso,

- 5 preferentemente, entre 0,1 y 90% en peso del principio activo. Los principios activos se usan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, de 95% a 100% (según espectro de NMR)

Ejemplos de formulaciones son 1 Productos para la dilución con agua

10

A) Concentrados solubles en agua (SL)

10 partes en peso de los principios activos son disueltos en agua o en un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se pueden adicionar humectantes u otros

- 15 auxiliares. El ingrediente activo se disuelve cuando es diluido con agua

B) Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de los principios activos son disueltos en ciclohexanona

- 20 adicionando un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión

C) Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de los principios activos son disueltos en xileno adicionando
dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5%
5 respectivamente) Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión

D) Emulsiones (EW, EO)

40 partes en peso de los principios activos son disueltos en xileno adicionando
10 dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5%
respectivamente) Esta mezcla es introducida en agua por medio de un emulsionante
(Ultraturrax) y transformada en una emulsión homogénea Diluyendo con agua, se
obtiene una emulsión

15 E) Suspensiones (SC, OD)

En un molino de bolas se trituran 20 partes en peso de los principios activos
adicionando un dispersante, humectante y agua o un disolvente orgánico,
obteniéndose una suspensión fina de ingrediente activo Diluyendo con agua, se
20 obtiene una suspensión estable del ingrediente activo

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

50 partes en peso de los principios activos son molidos finamente, adicionando
25 dispersantes y humectantes, y transformados en granulados dispersables en agua o

solubles en agua mediante dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusora, torre de pulverización, lecho fluidizado) Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable del principio activo

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

75 partes en peso de los principios activos son molidos en un molino de rotor-estator adicionando dispersante, humectantes y gel de sílice Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable con el principio activo

10

2 Productos para la aplicación directa

H) Polvos pulverizables (DP)

15 5 partes en peso de los principios activos son molidos finamente y mezclados íntimamente con 95% de un caolín finamente dividido Se obtiene un polvo pulverizable

I) Granulados (GR, FG, GG, MG)

20

0,5 partes en peso de los principios activos son molidos finamente y asociados con 95 5% de soporte Métodos actuales son extrusión, secado por pulverización y lecho fluidizado Se obtienen granulados que pueden ser aplicados sin dilución

25

J) Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

10 partes en peso de los principios activos son disueltos en un disolvente orgánico, por ejemplo, xileno. Se obtiene un producto que puede ser aplicado sin dilución.

5

Los principios 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

10 regado. Las formas de aplicación dependen enteramente del fin de aplicación, pero en todo caso hay que asegurar una distribución lo más fina posible de los ingredientes activos según la invención.

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

Las concentraciones en principio activo en las preparaciones listas para el uso pueden variar ampliamente. En general, varían de 0,0001 a 10%, preferentemente, de 0,01 a

1%

Los principios 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 aun el ingrediente activo sin aditivos

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

Cuando se usan como fungicidas, 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 o las composiciones según la invención como fungicidas con otros fungicidas, entonces se alcanza, frecuentemente, ampliar el espectro de acción

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

- acilalaninas, tales como benalaxilo, metalaxilo, ofuraçe, oxadixilo,

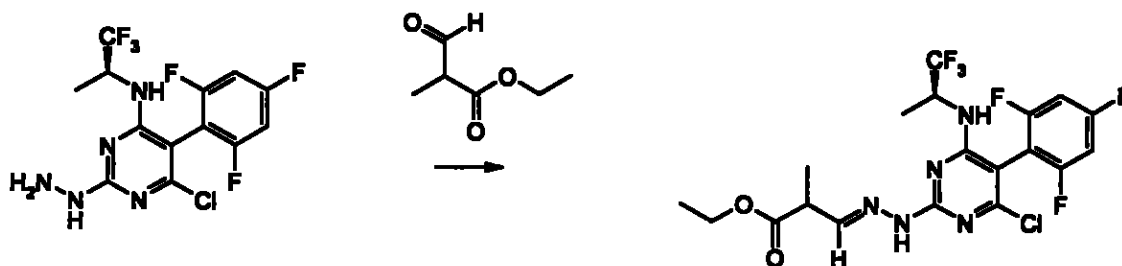
- derivados de amina, tales como aldimorf, dodine, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, indemorf,
- anilinopirimidinas, tales como pirmetanilo, mepanipirima o ciprodinilo,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina,
- 5 polioxina o estreptomicina,
- azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dintroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloroaz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol,
- 10 triticonazol,
- dicarboximidas, tales como Iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,
- ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, benomilo, boscalida,
- 15 carbendazima, carboxina, oxicarboxima, ciazofamida, dazomet, ditlanona, famoxadona, fenamidona, fenanmol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mepronilo, nuanmol, probenazol, proquinazida, pirfenox, piroquilon, quinoxifeno, siltotofam, tiabendazol, trifluzamida, tofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforona,
- 20 • fungicidas de cobre, tales como caldo de Burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacnlo, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles, tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,
- 25 • azufre,

- otros fungicidas, tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, cflufenamida, cimoxanilo, dazomet, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, fenmzona, fluazinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, flalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida,
- estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orsastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico, tales como captafol, captan, diclofluanida, toliifluanida,
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf

Ejemplos de síntesis

Síntesis de los productos intermedios de hidrazida

Ejemplo 1



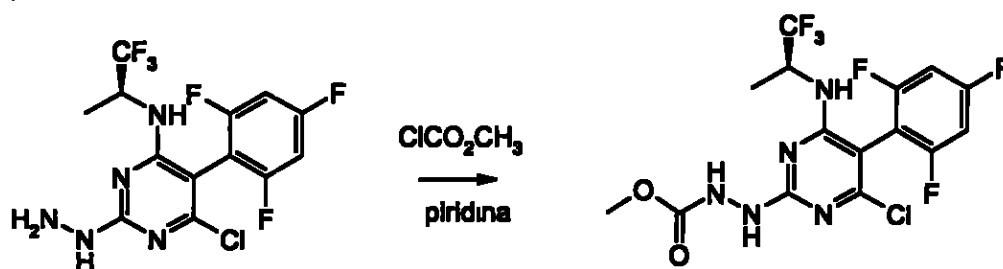
1.9 g (5 mmoles) de la hidrazida se introdujeron en 40 ml de éter dietílico. Entonces se agregaron 0.8 g (5.5 mmoles) del aldehído y se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El control de la reacción se efectuó mediante cromatografía (DC). Después

de haber eliminado el disolvente en el evaporador rotativo se purificó el producto cromatográficamente (DCM) Se obtuvo el producto como cristales de color beige

Rendimiento 64%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) = 1.2-1.3 (bm, 6 H), 1.4 (d, 3 H), 3.4 (m, 1 H), 4.2 (q, 2 H), 4.25 (d, 1 H, NH), 6.8 (m, 2 H), 7.3 (d, 1 H), 8.2 (bs, 1 H)

Ejemplo 2



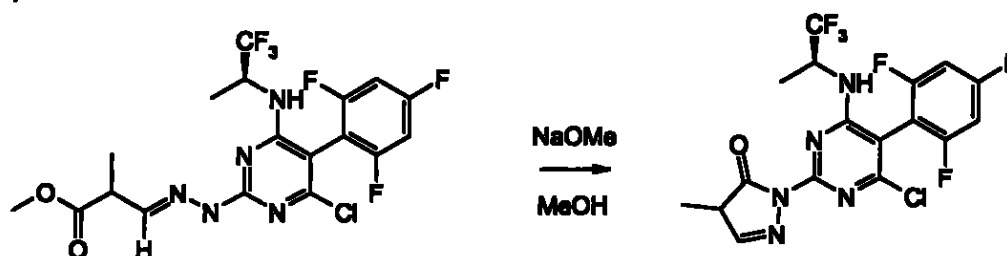
10

1.0 g (2.6 mmoles) de la hidrazida se disolvió en 1 ml de piridina absoluta. Entonces se agregaron 0.25 g (2.6 mmoles) de cloroformato de metilo y 5 ml de agua. Se agitó durante la noche. El control de la reacción se efectuó mediante cromatografía HPLC. Para la elaboración ulterior se filtró el sólido por succión y se lavó sucesivamente con 1.5 ml de agua destilada, dos veces con ácido acético al 10% y luego tres veces con agua. Después del secado se obtuvieron 0.9 g del producto (rendimiento de un 75%).

15

Ejemplos de principios activos

Ejemplo 3



5

1.4 g (3 mmol) de la hidrazona (Ejemplo 1) se disolvieron en 10 ml de metanol abs

Después de haber adicionado 0.6 g (3 mmoles) de solución de metilato sódico (al 30%

en metanol) se agitó ulteriormente durante la noche a temperatura ambiente. El control

de la reacción se efectuó mediante cromatografía HPLC. Después de haber eliminado

10 el disolvente en el evaporador rotativo se agitó la mezcla de reacción con agua

destilada y se reguló con ácido clorhídrico al 5% a pH 1-2. Se extrajo tres veces con

DCM y una vez con solución saturada de cloruro sódico. Los extractos reunidos se

secaron y se concentraron. El residuo se digirió con éter diisopropílico, se filtró por

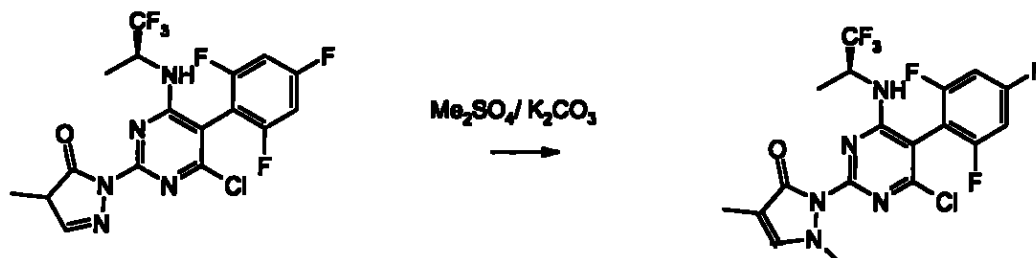
succión, se lavó con éter diisopropílico y n-pentano y se secó. El producto se obtuvo

15 como sólido incoloro. Rendimiento: 0.7 g (55%)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) ppm = 1.1 (d, 3 H), 1.4 (d, 3 H), 2.0 (s, 3 H), 4.9 (d, 1 H), 5.2 (m, 1 H),

6.9 (m, 2 H), 7.4 (d, 1 H)

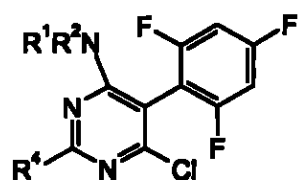
Ejemplo 4



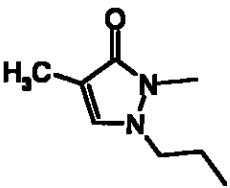
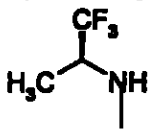
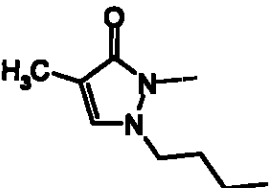
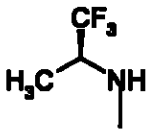
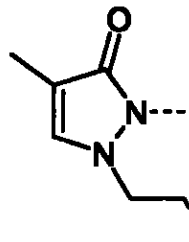
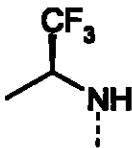
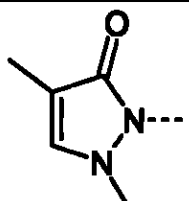
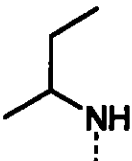
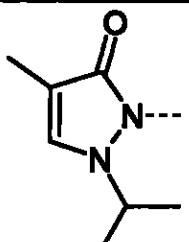
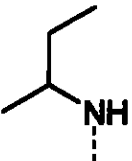
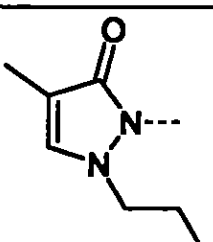
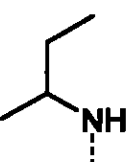
- 0 25 g de la pirimidina (Ejemplo 3) se disolvieron en 5 ml de metanol y se agregaron
5 0 15 g (1 2 mmol) de sulfo de dimetilo y 0 14 g (1 mmol) de carbonato de potasio Se
agitó ulteriormente durante tres horas a temperatura ambiente El control de la
reacción se efectuó mediante HPLC Se agregó otra vez sulfato de dimetilo (0 15 g,
1 2 mmol), de manera que la conversión era completa Para destruir el sulfato de
dimetilo excesivo se agitó con solución acuosa de amoníaco al 10% y diclorometano
10 (DCM) Después de la separación de las fases se extrajo la fase acuosa con DCM Las
fases orgánicas reunidas se lavaron con agua y luego se secaron Después de haber
eliminado el disolvente en el evaporador rotativo se purificó el producto mediante
cromatografía de columna (tolueno éster acético 9 1, 7 3) Rendimiento 100 mg
(38%)
- 15 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) ppm = 1 25 (d, 3 H), 1 8 (s, 3 H), 3 2 (s, 3 H), 5 0 (m, 1 H), 5 1 (m, 1
H), 6 8 (m, 2 H), 7 0 (m, 1 H)

Las prescripciones indicadas en los siguientes ejemplos de síntesis se pueden usar,
variando en forma correspondiente los compuestos de partida, para la generación de
20 otros compuestos I Los compuestos así obtenidos están indicados en la siguiente
Tabla A con sus datos físicos

Tabla B



No	R ⁴	NR ¹ R ²	Constantes físicas p f [°C]
I-01			aceite
I-02			p f 187-189°C
I-03			217-218
I-04			aceite
I-05			215-217
I-06			194-196
I-07			207-211

No	R ¹	NR ¹ R ²	Constantes físicas p f [°C]
I- 08			200-204
I- 09			acete
I- 10			acete
I- 11			155-157
I- 12			acete
I- 13			179-183

Ejemplos del efecto 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 las soluciones

10 madre se diluyeron con agua a la concentración deseada

Ejemplos de aplicación

1 Eficiencia duradera contra la marchitez temprana del tomate causada por *Alternaria solani* en el tratamiento protector

15

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

20

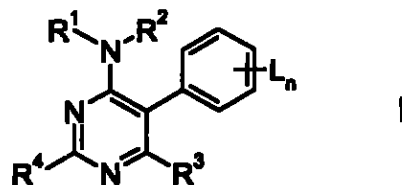
PF 54547

78

Las plantas tratadas con los principios activos según la invención presentaron una infestación marcadamente menor que las plantas no tratadas

Reivindicaciones

1 Pinmidinas 2-sustituidas de la fórmula I



5

en la que el índice y los sustituyentes tienen los significados siguientes

n es un número entero de 1 a 5, encontrándose por lo menos un sustituyente L en la posición orto en el anillo fenilo,

10

L significa halógeno, ciano, clonato (OCN), nitró, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-alquino, C₁-C₈-alcoxi, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A,

15

m es 0, 1 ó 2,

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alqueno, C₂-C₈-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalqueno,

20

fenilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o completamente halogenados o estar sustituidos por ciano o C₁-C₄-alcoxi, o pudiendo A y A' formar junto con los átomos, a los que están ligados, un heterociclo saturado, parcialmente no saturado o

aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

5 pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos de las definiciones de los radicales de L a su vez estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u

10 R^u significa halógeno, ciano, C_1-C_8 -alquilo, C_2-C_{10} -alquenilo, C_2-C_{10} -alquinilo, C_1-C_8 -alcoxi, C_2-C_{10} -alqueniloxi, C_2-C_{10} -alquiniloxi, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_3-C_8 -cicloalquenilo, C_3-C_8 -cicloalcoxi, C_3-C_8 -cicloalqueniloxi, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ o $S(=O)_m-N(A')A$, teniendo m, A, A', A'' los significados antes indicados y pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos a su vez
15 estar parcial o completamente halogenados llevar uno a tres grupos R^v , donde R^v tiene el mismo significado que R^u ,

20 R^1, R^2 significan, independientemente, C_1-C_8 -alquilo, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_2-C_8 -alquenilo, C_2-C_8 -alquinilo, C_1-C_8 -halógenoalquilo, C_3-C_8 -halógenocicloalquilo, C_2-C_8 -halógenoalquenilo o C_2-C_8 -halógenoalquinilo,

R^2 puede significar, adicionalmente, hidrógeno,

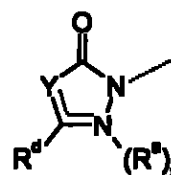
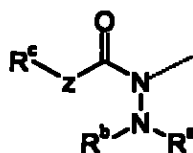
R^1 y R^2 también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo saturado o no saturado con cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter ($-O-$), carbonilo $C(=O)$, tio ($-S-$), sulfoxilo ($-S(=O)-$) o sulfonilo ($-SO_2-$).

5

R^3 significa halógeno, ciano, C_1-C_4 -alquilo, C_2-C_4 -alquenilo, C_2-C_4 -alquinilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_3-C_4 -alquenilo o C_3-C_4 -alquinilo, pudiendo los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo de R^3 estar sustituidos por halógeno, ciano, nitro, C_1-C_2 -alcoxi o C_1-C_4 -alcoxycarbonilo,

10

R^4 corresponde a una de las fórmulas



15

donde

x es 0 ó 1,

20

R^a , R^b y R^c significan, independientemente, hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_4-C_6 -cicloalquenilo,

R^a , R^b pueden significar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, $R^c-Z-C(R^d)=N$,

Z es oxígeno o N-R^c,

Y significa C(H)-R^a, C-R^a, N-N(H)-R^c o N-R^c,

5 — representa un doble o simple enlace,

R^d, R^e tienen los mismos significados que R^c y significan,
adicionalmente, halógeno o ciano,

10 R^d puede significar junto con el átomo de carbono, al que está
ligado, un grupo carbonilo,

pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos de las definiciones

de los radicales de R^a, R^b, R^c, R^d o R^e a su vez estar parcial o

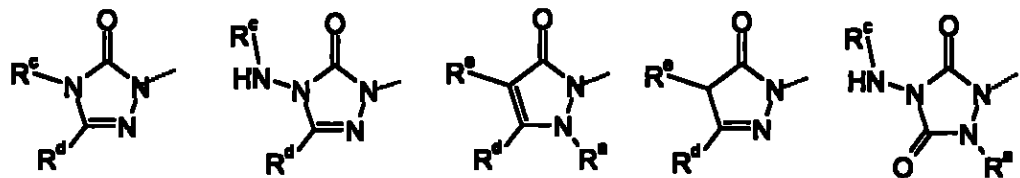
15 completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^w

R^w significa halógeno, ciano, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-
alquinilo, C₁-C₈-alcoxi, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₃-C₈-
cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-cicloalcoxi, C₃-C₈-

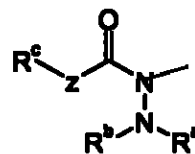
20 cicloalquenilo, y pudiendo dos de los radicales R^a, R^b o R^c formar
junto con los átomos, a los que están ligados, un heterociclo saturado,
parcialmente no saturado o aromático de cinco o seis miembros, que
contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S

2 Pirimidinas 2-sustituidas según la reivindicación 1, donde R^3 significa cloro, ciano, metilo, etilo o bromo

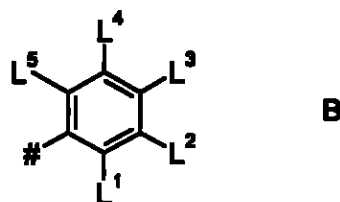
3 Pirimidinas 2-sustituidas según la reivindicación 1, donde R^4 corresponde a una
5 de las fórmulas



10 4 Pirimidinas 2-sustituidas según la reivindicación 1, donde R^4 corresponde a la fórmula



15 5 Pirimidinas 2-sustituidas según una de las reivindicaciones 1 a 6, donde el grupo
fenilo sustituido por L_n representa el grupo B



20 donde # representa el lugar de enlace con el esqueleto de pirimidina y

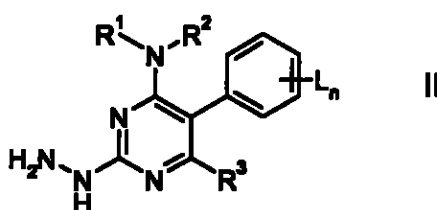
L^1 significa fluoro, cloro, CH_3 o CF_3 ,

L^2, L^4 significan, independientemente hidrógeno, CH_3 o fluoro ,

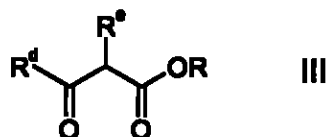
L^3 significa hidrógeno, fluoro, cloro, ciano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ o $COOCH_3$ y

L^5 significa hidrógeno, fluoro, cloro o CH_3

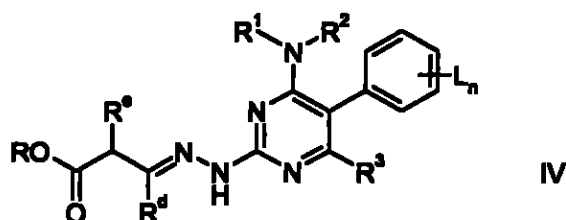
- 5 6 Procedimiento para la preparación de pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula I según la reivindicación 3, donde R^4 significa una pirazolona, caracterizado porque se condensa un compuesto de la fórmula II



- 10 en la que los sustituyentes L , R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 1, con un compuesto de 1,3-dicarbonilo de la fórmula III

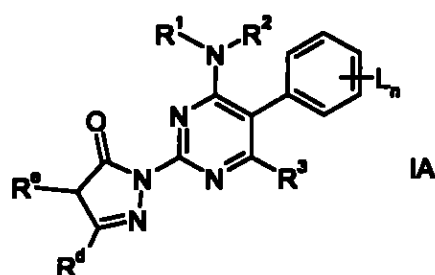


- en la que R^d y R^e tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y R representa un radical C_1-C_8 -alquilo y luego se cicliza el compuesto IV obtenido

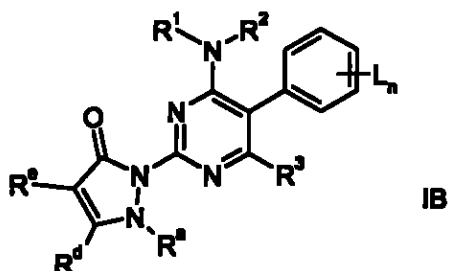


con una base dando IA

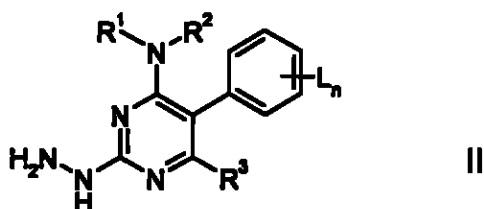
85



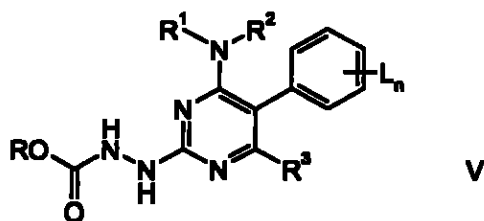
y se isomenza ,opcionalmente, dando IB



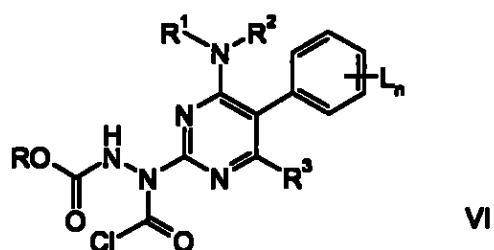
- 5 7 Procedimiento para la preparación de pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula I según la reivindicación 3, donde R^4 significa una triazolidiona, caracterizado porque se acila un compuesto de la fórmula II,



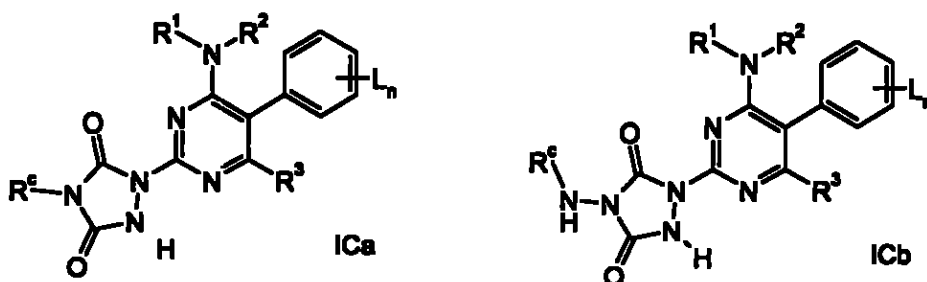
- en la que los sustituyentes L , R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la
10 reivindicación 1, con un cloroformiato de la fórmula $ClCO_2R$, donde el sustituyente R significa C_1-C_6 -alquilo, obteniéndose el compuesto V,



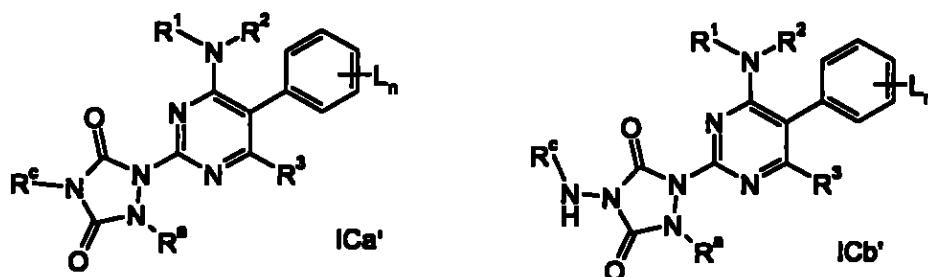
se transforma el compuesto V, luego, con un derivado de fosgeno en VI,



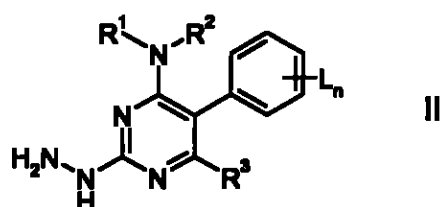
- 5 se cicliza VI, además, con una amina de la fórmula R^eNH_2 o bien una hidracina de la fórmula R^eNH-NH_2 dando los compuestos ICa o bien ICb



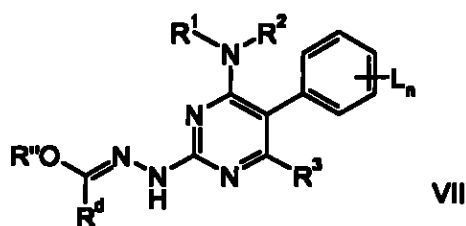
- y, opcionalmente, se transforman estos ulteriormente con un agente de
10 alquilación de la fórmula R^aX , donde R^a tiene el significados antes indicado y X representa un grupo disociable, como p ej un haluro o sulfato, en ICa' o bien en ICb'



- 8 Procedimiento para la preparación de pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula I según la reivindicación 3, donde R^4 representa una triazolidiona, caracterizado porque se condensa un compuesto de la fórmula II,

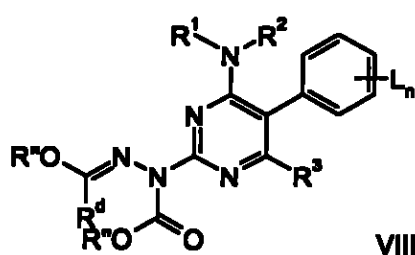


- 5 donde los sustituyentes L, R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 1, con un ortoéster de la fórmula $R^dC(OR'')_3$, donde el sustituyente R^d tiene los significados antes indicados y R'' significa C_1-C_6 -alquilo, obteniéndose el compuesto VII,



10

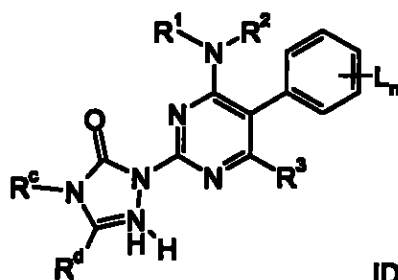
se acila el compuesto VII, luego, con un cloroformiato de la fórmula $ClCO_2R''$, donde el sustituyente R'' significa C_1-C_6 -alquilo dando el compuesto VIII



15

se cicliza VIII, además, con una amina de la fórmula R^eNH_2 dando el compuesto

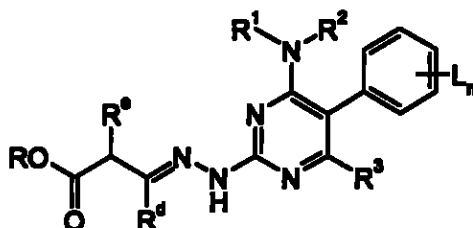
ID



ID

5

9 Compuestos de las fórmulas IV



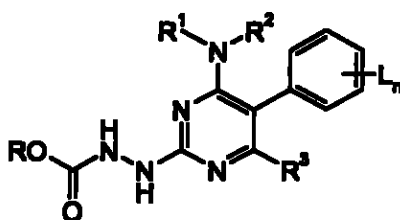
IV

10

donde los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 , L_n , R^5 y R^4 tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y el sustituyente R significa un radical C_1-C_8 -alquilo

10 Compuestos de las fórmulas V

15



V

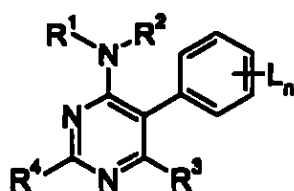
donde los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y L_n tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y el sustituyente R significa un radical C_1-C_8 -alquilo

- 11 Producto apropiado para combatir hongos nocivos, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1
- 12 Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a la infección por los hongos, con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula fórmula I según la reivindicación 1

Pinmidinas 2-sustituidas

Resumen

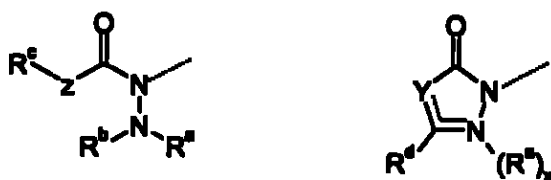
5 La presente invención se refiere a pirimidinas de la fórmula I,



en la que el índice n y los sustituyentes L, R¹ – R³ tienen los significados indicados en la descripción y

10

R⁴ corresponde a las fórmulas



15 así como a procedimientos y productos intermedios para la preparación de estos compuestos, a productos que las contienen, así como al uso de las mismas para combatir hongos nocivos fitopatógenos

20

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP2004/004957

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D239/48 C07D403/14 C07D403/04 C07D491/113 A01N43/54
A01N43/653

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, BEILSTEIN Data, MPI Data, PAJ, 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.
Y	WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM , BASF AG (DE), GEWEHR MARKUS (DE), LORENZ GISELA) 26 September 2002 (2002-09-26) cited in the application page 2, line 30 - line 46, claims, compounds I-1,I-2,I-4,I-29,(I-33)-(I-61)	1-12
Y	DE 34 19 127 A (BAYER AG) 28 November 1985 (1985-11-28) page 14, line 1 - line 12 page 28, line 13, claims, example 1, table 4	1-12
P,X	WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS , RHEINHEIMER JOACHIM (DE), BASF AG (DE), GEWEHR M) 30 May 2003 (2003-05-30) page 17, line 36 - page 19, line 11, claims 1,10,11, example 5, table 1, compounds I-65,I-113,I-222,I-267	1-12

☐ 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 (see 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

2 September 2004

Date of mailing of the international search report

10/09/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentamt 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hanisch, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/004957

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 02074753	A	26-09-2002	BR 0207975 A	15-06-2004
			CA 2440405 A1	26-09-2002
			CZ 20032475 A3	17-12-2003
			EE 200300448 A	16-02-2004
			WO 02074753 A2	26-09-2002
			EP 1373222 A2	02-01-2004
			SK 11422003 A3	06-04-2004
			US 2004116429 A1	17-06-2004
DE 3419127	A	28-11-1985	DE 3419127 A1	28-11-1985
			AT 68493 T	15-11-1991
			AU 571971 B2	28-04-1988
			AU 4256585 A	28-11-1985
			BR 8502395 A	21-01-1986
			CA 1261331 A1	26-09-1989
			DE 3584393 D1	21-11-1991
			DK 228385 A	24-11-1985
			EP 0165448 A2	27-12-1985
			ES 8606981 A1	01-11-1986
			GR 851252 A1	25-11-1985
			HU 38502 A2	30-06-1986
			IL 75240 A	31-07-1988
			JP 1941212 C	23-06-1995
			JP 6070033 B	07-09-1994
			JP 60255788 A	17-12-1985
			NZ 212119 A	31-08-1987
			PT 80466 A , R	01-06-1985
			US 4663327 A	05-05-1987
			ZA 8503876 A	29-01-1986
WO 03043993	A	30-05-2003	CA 2467683 A1	30-05-2003
			WO 03043993 A1	30-05-2003
			EP 1448532 A1	25-08-2004

INTERNATI NALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/004957

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D239/48 C07D403/14 C07D403/04 C07D491/113 A01N43/54
A01N43/653

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, BEILSTEIN Data, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitrag Anspruch Nr.
Y	WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM, BASF AG (DE), GEWEHR MARKUS (DE), LORENZ GISELA) 26 September 2002 (2002-09-26) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 30 - Zeile 46, Ansprüche, compounds I-1, I-2, I-4, I-29, (I-33)-(I-61)	1-12
Y	DE 34 19 127 A (BAYER AG) 28 November 1985 (1985-11-28) Seite 14, Zeile 1 - Zeile 12 Seite 28, Zeile 13, Ansprüche, Beispiel 1, Tabelle 4	1-12
P, X	WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS, RHEINHEIMER JOACHIM (DE), BASF AG (DE), GEWEHR M) 30 Mai 2003 (2003-05-30) Seite 17, Zeile 36 - Seite 19, Zeile 11, Ansprüche 1, 10, 11, Beispiel 5, Tabelle 1, compounds I-65, I-113, I-222, I-267	1-12

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

Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

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

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

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zusätzlich erschließen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen in 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

2 September 2004

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts

10/09/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.O. Box 1201, 8001 PH München 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-8040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Hanisch, I

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abkürzungszeichen

PCT/EP2004/004957

In Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 02074753 A	26-09-2002	BR 0207975 A	15-06-2004
		CA 2440405 A1	26-09-2002
		CZ 20032475 A3	17-12-2003
		EE 200300448 A	16-02-2004
		WO 02074753 A2	26-09-2002
		EP 1373222 A2	02-01-2004
		SK 11422003 A3	06-04-2004
		US 2004116429 A1	17-06-2004
DE 3419127 A	28-11-1985	DE 3419127 A1	28-11-1985
		AT 68493 T	15-11-1991
		AU 571971 B2	28-04-1988
		AU 4256585 A	28-11-1985
		BR 8502395 A	21-01-1986
		CA 1261331 A1	26-09-1989
		DE 3584393 D1	21-11-1991
		DK 228385 A	24-11-1985
		EP 0165448 A2	27-12-1985
		ES 8606981 A1	01-11-1986
		GR 851252 A1	25-11-1985
		HU 38502 A2	30-06-1986
		IL 75240 A	31-07-1988
		JP 1941212 C	23-06-1995
		JP 6070033 B	07-09-1994
		JP 60255788 A	17-12-1985
		NZ 212119 A	31-08-1987
		PT 80466 A ,B	01-06-1985
		US 4663327 A	05-05-1987
		ZA 8503876 A	29-01-1986
WO 03043993 A	30-05-2003	CA 2467683 A1	30-05-2003
		WO 03043993 A1	30-05-2003
		EP 1448532 A1	25-08-2004

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

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

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054547	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA16	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/004957	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 10.05.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 20.05.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D239/48, C07D403/14, C07D403/04, C07D491/113, A01N43/54, A01N43/53		
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 5 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 807 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/enhalten nur in computerlesbarer 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 02.10.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 16.08.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx 523856 epmu d Fax +49 89 2399 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Hantsch, I Tel. +49 89 2399-7880 	

Feld Nr 1 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

1-53 In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr

1 12 In der ursprünglich eingereichten Fassung

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

- 3 ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen
- ☐ Beschreibung Seite
 - ☐ Ansprüche Nr
 - ☐ Zeichnungen Blatt/Abb
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*)
- 4 ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70 2 c))
- ☐ Beschreibung Seite
 - ☐ Ansprüche Nr
 - ☐ Zeichnungen Blatt/Abb
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*)

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

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/004957

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	1-12
	Nein	Ansprüche	
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja	Ansprüche	1-9,11,12
	Nein	Ansprüche	10
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja	Ansprüche	1-12
	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

Im vorliegenden Bescheid wird auf die folgenden Dokumente verwiesen

(A) WO 02074753

(B) DE 3419127

Neuheit

Die vorliegenden Fungizide und Zwischenprodukte der Ansprüche 1,9 und 10 scheinen die Erfordernisse des Artikels 33(2) PCT zu erfüllen. Der mit (A) überlappende Teil der allgemeinen Formel wird als eine neue Auswahl aus (A) angesehen und die vorliegenden Verbindungen unterscheiden sich von (B) im wesentlichen durch die beiden Pyrimidinsubstituenten "NR¹R²" und "Phenyl-L_n".

Erfindersche Tätigkeit

Die der vorliegenden Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe scheint die Bereitstellung weiterer Fungizide zu sein. (A) wird als der nächste Stand der Technik angesehen. (A) offenbart Verbindungen mit der gewünschten Aktivität in einer allgemeinen Formel, die einen Grossteil der vorliegenden Verbindungen umfasst. Im Falle eines derart nahen Stands der Technik kann eine erfinderische Tätigkeit im Sinne von Artikel 33(3) PCT nur anerkannt werden, wenn die vorliegenden Verbindungen eine unerwartete Verbesserung gegenüber dem nächsten Stand der Technik aufweisen. Ein derartige unerwartete Verbesserung, die auf die vorliegende Carbonylgruppe im Substituenten R⁴ zurückführbar ist, konnte durch den mit dem Schreiben vom 09.03.05 eingereichten ersten Vergleichsversuch gezeigt werden. Eine erfindersche Tätigkeit wird auch den vorliegenden Zwischenprodukten aus Anspruch 9 zuerkannt, da sie die besagte Carbonylgruppe enthalten. Jedoch gilt dies nicht für die Zwischenprodukte aus Anspruch 10, die als eine von mehreren möglichen Standardvorgängern der herzustellenden Fungizide nicht als per se erfindersch angesehen werden.

Zu Punkt VI

WO 03043993 (=Dokument (C)) wird als intermediäres Dokument während der internationalen Phase nicht berücksichtigt. Es sollte jedoch bereits beachtet werden, dass die vorliegende Anmeldung bis auf "L= NO₂" zu recht die beanspruchte Priorität zu genießen scheint, so daß (C) keinen Stand der Technik für die Beurteilung der

erfinderischen Tätigkeit darstellt. Die Verbindungen von (C) unterscheiden sich von den vorliegenden durch den Substituenten "R⁴".

Refno Folio 155 "Extrado"

Expediente No		05116329	No de Folio
Item		No de Unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	1	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		
Observaciones: Arte final			

156
~~157~~
2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 05116323 00000000 Folios: 157
Fecha (AMB): 2005-11-16 19:20:10
Tramite : 011 PAT-PATENT 379 FASE INICI 411 PRESENTAC
Para el caso de la INSTITUCION DE MEDIO AMBIENTE

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 87,637
FECHA : NOVIEMBRE 15 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	27496710	15/11/2005	56,100,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 00361-841-063-7

157

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radacion : 05115329 00000000
Fecha (HND): 2005-11-16 15:20:10
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 411 PRESENTAC
Remanente: 2401 INVENTOS DE INGENIERIA

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION <i>PCT</i> MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
- 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 <i>(X)</i>		
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:

158

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio ~~159~~

2020
Bogotá D C ,

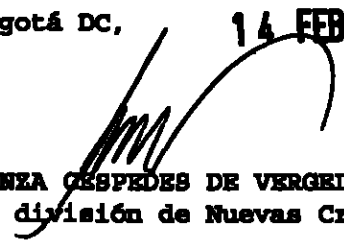
Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No	05 116329
	Solicitud internacional	EP2004/004957
	Fecha inicio fase nacional	20/12/2005
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No	13
	Folios	1

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

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

14 FEB 2006


ALIX CARMONA OSPINA DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa11