

Q.P.



Industria y Comercio

S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21 EXPEDIENTE No.

05-122253

54 TÍTULO

TRIAZOLOPIRIMIDINAS SUSTITUIDAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU OBTENCION
Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO

PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71 SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

Ludwigshafen, República Federal de Alemania,

74 APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22 BOGOTÁ, D. C.,



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

REGISTRARÍA Y DISEÑO
Registación: 6512353 00000000 Folios: 154 don
Fecha (MM/AA) 2005-12-01 17:01:36
Trámite 011 PCT-PAIENI 379 PAE: NUL 411 PRESENTAL
Dependencia 0000 DIVISION DE NULVS DEPCIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 SOLICITUD DE		
☒ Patente de Invención ☐ Patente de Modelo de Utilidad ☐ Capítulo I ☒ Capítulo II		
2 LICITANTE (71)	Nombre BASF AKTIENGESSELLSCHAFT sociedad constituida y existente bajo las leyes de Republica Federal de Alemania Dirección 67056 Ludwigshafen, República Federal de Alemania Domicilio Ludwigshafen, República Federal de Alemania	IDENTIFICACIÓN C C ☐ NIT ☐ C E ☐ Otro ☐ Cual _____ Numero _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre EMILIO FERRERO Dirección Carrera 4ª No 72-35 Teléfono 347 36 11 Fax 211 86 50 E-mail clientes@camyp.com Domicilio Bogotá Colombia	IDENTIFICACIÓN C C ☒ NIT ☐ C E ☐ Otro ☐ Cual _____ Numero 438 019 T P 31 929
4 INVENTOR (ES) (72)	1 Oliver WAGNER Im Meisental 50, 67433 Neustadt República federal de Alemania 2 Thomas GROTE Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim, República Federal de Alemania 3 Carsten BLETNER Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim 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 Andreas GYPSE B4 4 68159 Mannheim República Federal de Alemania 7 Bernd MÜLLER Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal República Federal de Alemania 11 Anja SCHWÖGLER Heinrich-Lanz-Strasse 3, 68165 Mannheim República Federal de Alemania 12 Jordi TORMO I BLASCO Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudenbach República Federal de Alemania 13 Alan AKERS 120 Avenue de Strasbourg, 67170 Brumath, Francia 14 Jhon-Bryan SPEAKMAN In den Hahndomen 7, 67273 Bobenheim República Federal de Alemania 15 Michael RACK Sandwinger 67 69123 Heidelberg, República Federal de Alemania 16 Reinhard STIERL Jahnstr 8, 67251 Freinsheim República Federal de Alemania 17 Maria SCHERER Hermann-Jürgens-Strasse 30 76829 Godramstein República Federal de Alemania	

	8 Joachim RHEINHEIMER Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen, República Federal de Alemania	18 Ulrich SCHÖFL Erlenstr 8 68782 Brühl, República Federal de Alemania
	9 Peter SHÄFER Römerstr 1, 67308 Ottersheim, República Federal de Alemania	19 Siegfried STRATHMANN Donnersbergstr 9 67117 Limburgerhof República Federal de Alemania
	10 Frank SCHIEWECK Lindenweg 4 67258 Hessheim, República Federal de Alemania	

5 PCT (86)
Solicitud Internacional No PCT/EP2004/005694 Fecha 27 de mayo de 2004
Publicación Internacional No WO 2004/106341 A1 Fecha 9 de diciembre de 2004

6 TÍTULO (54) TRIAZOLOPIRIMIDINAS SUSTITUIDAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU OBTENCION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN

7 Clasificación Internacional (51) C07D 487/04

8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	<u>DE</u>	<u>03/08/2003</u>	<u>103 25 244 4</u>
	<u>DE</u>	<u>04/08/2003</u>	<u>103 35 980 5</u>
	<u>DE</u>	<u>05/02/2004</u>	<u>10 2004 005 910 1</u>

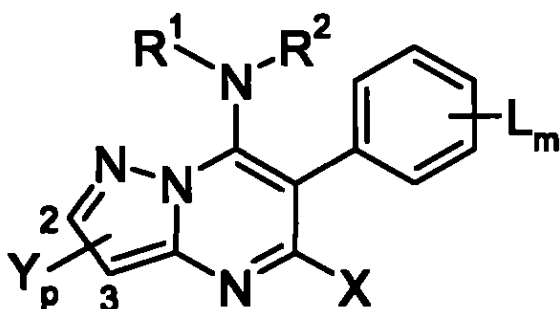
9 Comprobante de pago No 05 - 87 649 Fecha 15 de noviembre de 2005

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 2004/106341 A1

Descripción

Páginas 43 en el idioma original

Páginas 67 en español

Reivindicaciones Número (s) 16

Figuras Número (s)

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

- 3 ☒ Extracto de publicación

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros) abajo firmado(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° 72-35, Bogotá Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o 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 Consulado de Colombia, en el extranjero, y si se tratare de impedimento con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente en su caso podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizamos (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 al registro de marcas de fábrica, colectivas defensivas y de servicios, el depósito de nombres comerciales y enseñas, su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria, y el registro de licencias de uso de esos derechos b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, con cesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistirse, cancelar, recibir, renunciar y ratificar los actos hechos por agentes oficiales.

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

ppa Welzel

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

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft.

wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831, ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519, und EMILIO FERRERO, tpa. 31929, wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Mäandungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fälle der Hauptvertreter oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung ausüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten oder Kolumbianischen Konsul im Auslande und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendet, einer oder anderen, ordnungsgemäss werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Ausserdem und unter diesen Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen Registrierung von Waren- Schmell-Defensive- und Service-zeichen Aufbewahrung von Handelsnamen- und zeichen Ihre Erneuerung und Übertragung, Namen und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertraglizenzen, b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtmassnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf- Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und, c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davor, Abstand nehmen, annäheren, empfangen, verzichten, das Recht ausüben und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen des Bevollmächtigten vollziehen.

Unterzeichnet

in D-6700 Ludwigshafen NOV 2005

Unterschrift

ppa Richters



U R Nr 1407/89

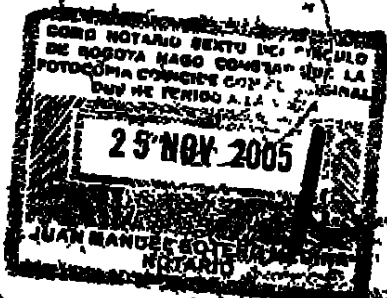
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorstehend
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren

- 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-
scheine ich, daß die Herren Dr Welzel und Dr Richters
als Prokuristen gemeinschaftlich zur Vertretung und
Zeichnung der Firma BASF Aktiengesellschaft mit dem
Sitz in Ludwigshafen am Rhein berechtigt sind

Ludwigshafen am Rhein, den 17 März 1989



[Handwritten signature]

als ar. ... Vertreter
des Not. ...

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

Thomas W a l t e r

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)



Kostenvermerk Gebühr 20,-- DM

LUZ ARRIBA DE ALPBER
INSTRUMENTA 1-1-1
AL
100 A 2002
B
Brevetado No 855 Pichincha



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 RASF Aktiengesellschaft-----
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
de la República Federal de Alemania y cumple su objeto
conforme a las mismas, que el(los) señor(es) Dr Gunther
WELZEL y el Dr Peter RICHTERS-----
quien(es) en sus carácter(es) de apoderados-----
----- y cuyo poder-----
(fueron) autenticada(s) ante el Notario-----
----- es(son)-----
te(s) legal(es) en este país.

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

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

Frankfurt a M 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por 403 6 - de los 400 000 000



Nº-0077

Martha Niño de Stand
Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

SECRET

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 12 de ABR 1988 No. 8506-1
Of. el 20/11/88
Martha Nino
cuyo firma aparece en el presente
documento, dando fe de que el
documento es original.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
QUE SE TENDIO A LA VISTA
25 NOV 2005
JUAN MANUEL SOTELO MEDINA
NOTARIO

[Signature]
JOSÉ LUIS ACUÑA
crales



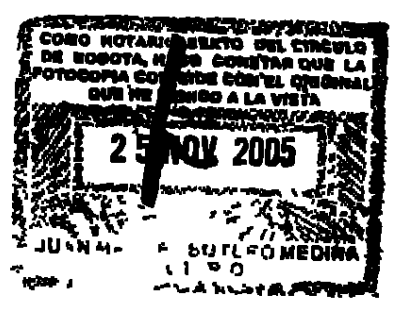
CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

N.º 1.111

2

15/11/05 GENE

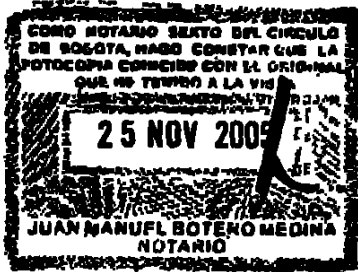
15/11/05 GENE



Die konsularische Legalisierung ist notwendig

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

Handwritten signature or mark.



8

TRADUCCION OFICIAL NO 2056

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

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

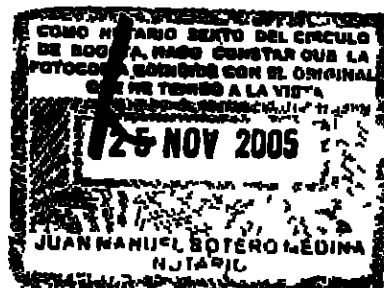
Protocolo notarial No 1407/89

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

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

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona

1



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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo)

Dr Siegfried Kohler

Fdo : firma ilegible

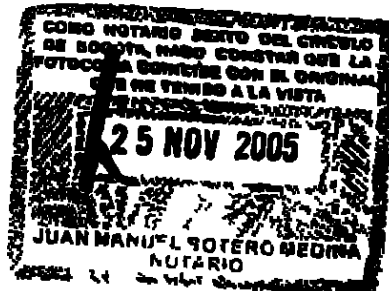
Notario de Ludwigshafen

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



10
El Presidente del Tribunal Regional

Fdo firma ilegible (sello redondo)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota Derrechos 20,-- DM

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

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

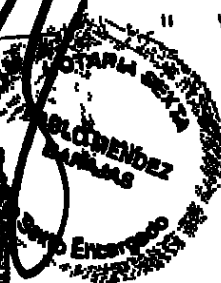
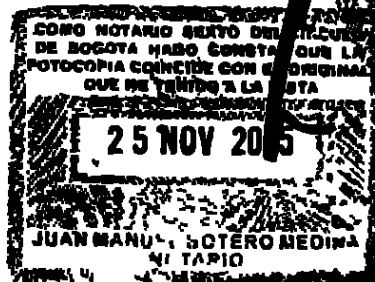
Registación No 599 Minjusticia

CCM
FOSOT
FID - 2.11

LUZ Arriaga de Herben

05 AGO 1999

SA ITAS



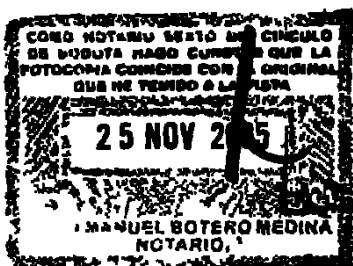
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá 28 APR 1985 No. 89010

PAGE CONTAR

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



El Jefe Consular
 Encargado

LEA LAS INSTRUCCIONES GENERALES
RECUERDE QUE TODOS LOS NÚMROS

EL VALOR DEL BORRADOR DE ESTE FORMULARIO
DEBEN ESTAR DEBIDAMENTE CON ALGUN VALOR EN CASO CONTRARIO, ESCRIBA CERO (0)

881051599954



DECLARACIÓN Y PAGO DEL
IMPUESTO D
TIMBR
NACIONAL

16 013 01 000045 1

16 013 01 000045 1

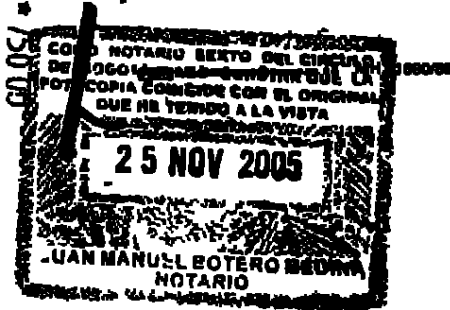
1 Administración de Impuestos de: BOGOTÁ		Código: 03	2 Teléfono: 2120100
3 Documento de identificación (marque X) C.C. o T.I. ☐ NIT ☒ No. 860041367 D.V. ☒		4 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres): CAVELIER ABOGADOS	
5 C.C. o T.I. ☒ NIT ☐ No. 19' 301.629 D.V. ☐		6 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres): FORERO ROCHA JAIME	
7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la celda 4): Cra 4a No. 72-35		Municipio: BOGOTÁ	Departamento: CUNDINAMARCA
8 Número documento: 1			
9 Relación oficial 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			

FIRMA	Responsable del pago
	Nombre: 19' 301.629

1 VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	750
2 Sanciones	0
3 Impuesto de mora	0
4 TOTAL A PAGAR (sumas de 1 + 2 + 3)	750
5 Efecto: ☒ No. ☐	
6 Código: ☐ No. ☐	

DEM-31-V-88

CONTRIBUYENTE



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

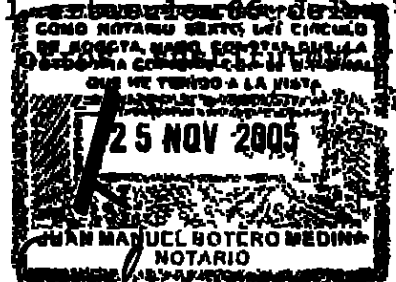
Poderdante BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el 17-03-89

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder conferido en el doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No 31 929, con todas las facultades que me fueron conferidas

Hago la anterior sustitucion conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los documentos que 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 compareció el Doctor EMILIO FERNANDEZ

quien exhibió la cédula de ciudadanía numero 6739 971
expedida en 4/Ago 94 y la tarjeta profesional
numero 21 929 del Ministerio de Justicia con
el presente documento dirigido a R. P. HUARIS (ASACUHE)
y declaro que la firma que aparece en este es suya.

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 compareció el Doctor GERARDO

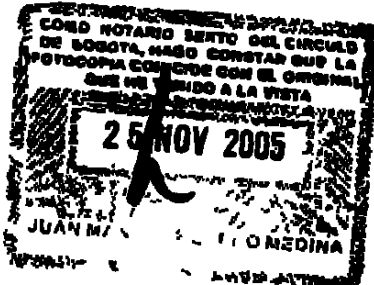
quien exhibió la cédula de ciudadanía numero 2072224
expedida en 26 y la tarjeta profesional
numero 637 del Ministerio de Justicia con
el presente documento dirigido a Diosdado Novoa Arce
y declaro que la firma que aparece en éste es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



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

5043
Colombia / 3

0000054619

CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
Thomas Grote
Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr
Goethestr 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Andreas Gypser
B 4, 4, 68159 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller
Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal
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

CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98



Anya Schwöglér
 Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim
 Germany
 Citizen of Germany
 Jordi Tormo i Blasco
 Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudenbach
 Germany
 Citizen of Spain
 Alan Akers
 120 Avenue de Strasbourg, 67170 Brumath
 France
 Citizen of United Kingdom
 John-Bryan Speakman
 In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim
 Germany
 Citizen of United Kingdom
 Michael Rack
 Sandwingert 67, 69123 Heidelberg
 Germany
 Citizen of Germany
 Reinhard Suerl
 Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
 Germany
 Citizen of Germany
 Maria Scherer
 Hermann-Jürgens-Str 30, 76829 Landau (Godramstein)
 Germany
 Citizen of Germany
 Ulrich Schöfl
 Luftschifftring 22c, 68782 Brühl
 Germany
 Citizen of Germany
 Siegfried Strathmann
 Donnersbergstr 9, 67117 Lünburgerhof
 Germany
 Citizen of Germany

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)
 inventor(es) de la invención *pirazolo pirimidinas*
substituidas, procedimientos para su obtención
y el uso de las mismas para combatir
hongos nocivos. Así como productos que
las contienen
 declaro(amos) así mismo que cedo(amos) y
 transfiero(amos), sin limitación, a favor de la sociedad

BASF Aktiengesellschaft

constituida y existente de conformidad con las leyes de

Allemagne

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

Substituted pyrazolopyrimidines, their preparation
 and their use for controlling harmful fungi, and
 compositions comprising them

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

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with the laws of

Germany

Ik

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

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

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
Firma Signature



Oliver Wagner



Thomas Grote



Carsten Blettner



Markus Gewehr



Wassilios Grammenos



Andreas Gypser



Bernd Müller



Joachim Rheinheimer



Peter Schäfer





Frank Schieweck



Anja Schwöglér



Jordi Tormo i Blasco

X 

Alan Akers



John-Bryan Speakman



Michael Rack



Reinhard Suerl



Maria Scherer



Ulrich Schöfl



Siegfried Strathmann



AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUO)

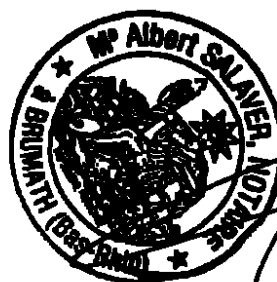
NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

A los 11 días del mes de May de 2004

On this 11 day of May 2004

ante mí Notario Público de Brumath

before me, a Notary Public of Brumath

compareció(eron) personalmente M. Alan Ackers
nac 05-08-1945 a SHEFFIELDpersonally appeared M. Alan Ackers
Born 05-08-1945 in SHEFFIELD
(GB)a quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y
quien(es) tiene(n) capacidad legal para otorgarloto me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who has (have)
legal capacity to execute it

Notario Público

Notary Public

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Colombia

1 République française

Le présent acte public:

2 - a été signé par M. Salaver

3 agissant en qualité de Notaire

4 est revêtu du sceau de son étude sise

a Brumath (Bas-Rhin)

Assisté France

5 à COLMAR 6 le 18 mai 2004

7 Affirmé Procureur général près la cour d'appel

8 sous le n° 1320404

10 Signature



Notarization and legalized by means of Apostille

François JURDEY
Avocat Général

JK

18 -

TRADUCCIÓN OFICIAL No 16 11/05 preparada por María Elvira Martelo, traductora oficial aprobada por el Ministerio de Justicia mediante resolución 2879 de 1995 y reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores

Colombia

0000054619

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento de Cesión escrito en inglés y español, por el cual

Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania
Ciudadano alemán

Thomas Grote
Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania
Ciudadano alemán

Carsten Blettner
Richard-Waner-Str 48, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadano alemán

Markus Gewehr
Goethestrabe 21, 56288 Kastellaun, Alemania
Ciudadano alemán

Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania
Ciudadano griego

Andreas Gypser
B 4, 4, 68159 Mannheim, Alemania
Ciudadano alemán

Bernd Muller
Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal, Alemania
Ciudadano alemán

Joachim Rheinheimer
Merziger Str 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania
Ciudadano alemán

Peter Schafer
Romerstr 1, 67308 Ottersheim, Alemania
Ciudadano alemán

Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Hebbheim, Alemania
Ciudadano alemán

Anja Schwögler
Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadano alemán

Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania
Ciudadano español

Alan Akers
120 Avenue de Strasbourg, 67170 Brumath, Francia
Ciudadano del Reino Unido

John-Bryan Speakman
In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Alemania
Ciudadano del Reino Unido

Michael Rack
Sandwingert 67, 69123 Heidelberg, Alemania
Ciudadano alemán

Reinhard Stierl
Jahnstr 8, 67251 Freinsheim, Alemania
Ciudadano alemán

Mana Scherer
Hermann-Jurgens-Str 30, 76829 Landau (Godramstein), Alemania
Ciudadano alemán

Ulrich Schoff
Luftschiffning 22c, 68782 Bruhl, Alemania
Ciudadano alemán

Siegfried Strathmann
Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof, Alemania
Ciudadano alemán

inventores de la invención "**Pirazolopirimidinas sustituidas, procedimiento para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen**", ceden los derechos inherentes a dicha invención a **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**, sociedad de Alemania domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania

Dado y firmado hoy (en blanco)

Firmas

Oliver Wagner

Thomas Grote

Carsten Blettner

Markus Gewehr wehr

Wassilios Grammenos

Andreas Gypser

Bernd Müller
Joachim Rheinheimer
Peter Schäfer
Frank Schleweck
Anja Schwögler
Jordi Tormo i Blasco

(Firmado)
Alan Akers

John-Bryan Speakman

Michael Rack

Reinhard Sterl

Maria Scherer

Ulrich Schöfl

Siegfried Strathmann

RECEIVED
NOTARIAL
2004 10 18 15 55
NOTARIAL
2004 10 18 15 55

CERTIFICACIÓN NOTARIAL (INDIVIDUO) en inglés y español referente a la firma de
ALAN AKERS que anteceden y a su capacidad para otorgar el documento.
(Firma ilegible), Notario Publico (Sello notarial del Sr. Albert SALAVER, Notario)

Apostilla otorgada en Francia bajo el No 1320/04 y lleva el sello de Francois
JURDEY, cuya traducción se anexa a la presente

RECEIVED
NOTARIAL
2004 10 18 15 55
NOTARIAL
2004 10 18 15 55

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia para su confrontación

COLO 00361-841-066-0
WPCL 0361 - ID 4246
NOV 15/05

Maria Elvira Martelo
TRADUCCION No. 161165
MARIA ELVIRA MARTELO
Traductora e Interprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Res. No. 2879 Min. Justicia

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

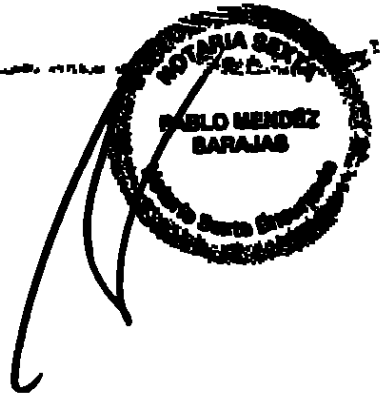
Maria Mercedes
189324
COTA FUENTE APARECE EN EL
DOCUMENTO RESERVENA
LAS FUENTES INDICADAS

BOGOTÁ
REPUBLICA DE COLOMBIA

2005 NOV 18 P 12:22

NOTA DE DESPACHO
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRM(A)S, DE
Yauri Quira
Yostolo
CONCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (E)LOS) EN ESTA NOTARIA
SANTAFE DE BOGOTA.
18 NOV 2005



21

TRADUCCIÓN OFICIAL No 299/05 DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN FRANCÉS, EL CUAL PARA SU IDENTIFICACIÓN SE SELLA CON EL SELLO DEL TRADUCTOR ESTA ES UNA TRADUCCIÓN OFICIAL EFECTUADA EL DIA 16 DE NOVIEMBRE DE 2005 POR JEAN-JACQUES TURPIN, C E 193849 DE BOGOTA, TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL SEGUN RESOLUCIÓN No 2680/91 DEL 19 DE DICIEMBRE DE 1991, EXPEDIDA POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA DE COLOMBIA

ADICIÓN A LA TRADUCCIÓN OFICIAL NO 16 11/05 REALIZADA POR MARÍA ELVIRA MARTELO EL 16 DE NOVIEMBRE DE 2005, TRADUCTORA OFICIAL SEGUN RESOLUCIÓN NO 2879 DE 1995

Autenticaciones que hallan a continuación de un documento de cesión confendo en inglés y español por (ver lista en inglés de los inventores) quienes ceden la invención "Pirazolopirimidinas sustituidas, procedimiento para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen" a BASF AKTIENGESELLSCHAFT, sociedad alemana domiciliada en 67056, Ludwigshafen, Alemania

Firma de Alan Akers

Legalización con fecha del 11 de mayo de 2004, de la firma de Alan Akers, nacido el 05 de agosto de 1945 en Sheffield, Gran-Bretaña, por el Señor Albert Salavier, Notario en Brumath, Firma ilegible del Notario

Sello Albert Salavier, Notario en Brumath (Bas-Rhin) – Republica Francesa

APOSTILLA

(Convención de La Haya del 5 de octubre de 1961)

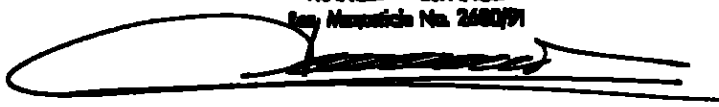
Colombia

1 Republica Francesa

1

299/05

Traducción Oficial No.
JEAN - JACQUES H. TURPIN
Traductor e Interpreté Oficial
FRANCOIS - ESPAGNOL
Seg. Min. Justicia No. 2680/91



- El presente documento publico
- 2 ha sido firmado por el Señor Salavier
- 3 obrando en calidad de Notario
- 4 con sello de su Notaria en Brumath (Bas-Rhin), Francia

CERTIFICADO

- 5 En Colmar
- 6 El 18 de mayo de 2004
- 7 Por el Procurador general ante el Tribunal Superior
- 8 Bajo el N° 1320/04
- 9 Sello Tribunal Superior de Colmar – Republica Francesa
- 10 Firma ilegible de François JURDEY, funcionario del Ministerio Público

Esta es una traducción fiel y completa de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su confrontación, a la cual me remito

T O 299/05
Colo 02361-841-066-0
Traductor Jean-Jacques Turpin
Bogotá, D C , 15 de noviembre de 2005

299/05
2005-11-15
15 de noviembre de 2005
JURDEY
Firma ilegible de François JURDEY, funcionario del Ministerio Público
Sello Tribunal Superior de Colmar – Republica Francesa
2005-11-15
15 de noviembre de 2005

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

189334
Jean Turpin
ESTA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESENTADA
LAS FUENTES MENDIZABAL

NOTA: ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 NOV 18 P 12:22

1148
DIRECCION DE RELACIONES
EXTERIORES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S)
Juan Turpin
CONCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTAFE DE BOGOTA.
18 NOV 2005

NOTARIA SANTA
PABLO MENDEZ
BARRIAS

0000054619

CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

- / **Oliver Wagner**
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
- / **Thomas Grote**
Im Höhenhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
- Carsten Blettner**
Richard-Wagner-Str 48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
- / **Markus Gewehr**
Goethestr 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
- / **Wassilios Grammenos**
Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
- / **Andreas Gypser**
B 4, 4, 68159 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
- / **Bernd Müller**
Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
- / **Joachim Rheinheimer**
Merzger Str 24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
- / **Peter Schäfer**
Römerstr 1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany
- / **Frank Schueweck**
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

- ✓ Anja Schwöglar
Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
- ✓ Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudenbach
Germany
Citizen of Spain
- ✓ Alan Akers
120 Avenue de Strasbourg, 67170 Brumath
France
Citizen of United Kingdom
- ✓ John-Bryan Speakman
In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim
Germany
Citizen of United Kingdom
- ✓ Michael Rack
Sandwingert 67, 69123 Heidelberg
Germany
Citizen of Germany
- ✓ Reinhard Silerl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany
- ✓ Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str 30, 76829 Godramstein
Germany
Citizen of Germany
- ✓ Ulrich Schöffl
Erlenstr 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
- ✓ Siegfried Strathmann
Donnersbergstr 9, 67117 Lumburgerhof
Germany
Citizen of Germany

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)
inventor(es) de la invención *pirazole pirimidinas sustituidas*
procedimientos para su obtención y el uso de las
mismas para combatir hongos nocivos en
estos productos que las contienen

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

Reichmanien

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

Substituted pyrazolopyrimidines, their preparation
and their use for controlling harmful fungi, and
compositions comprising them

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

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Germany

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

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

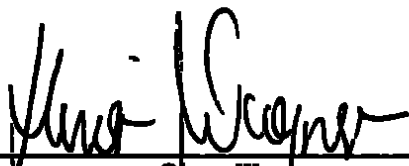
all rights inherent to said invention and that the above mentioned company hereby is enabled to apply, in its name for the corresponding patent in the Republic of Colombia

Dado y firmado hoy

Given and signed this 03, Juni 2004

Firma

Signature


Oliver Wagner


Thomas Grote


Carsten Blettner

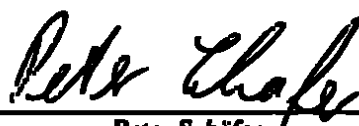

Markus Geyhr


Wassilos Grammenos


Andreas Gypser


Bernd Müller


Joachim Rheinheimer


Peter Schäfer

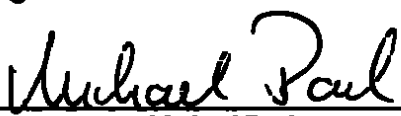

Frank Schieweck


Anja Schwögl

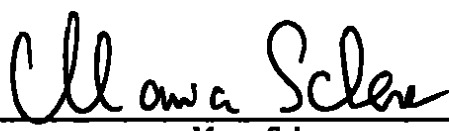

Jordi Torno i Blasco


Alan Akers


John-Bryan Speakman


Michael Rack


Reinhard Suerl


Maria Scherer


Ulrich Schöfl


Siegfried Strathmann

AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUO)

NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

A los días del mes de de 200

On this 3rd day of June 2004

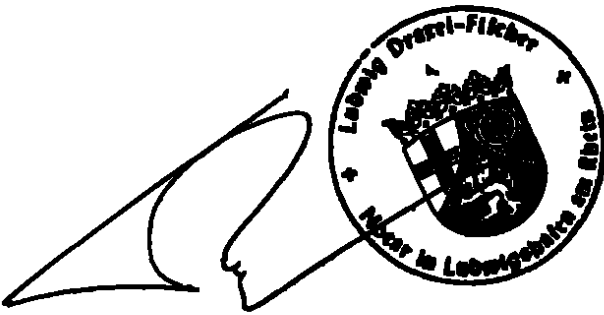
ante mí, Notario Público de

compareció(eron) personalmente

before me, a Notary Public at Ludwigshafen,
Federal Republic of Germany
personally appeared Oliver Wagner, Thomas
Grote, Carsten Blettner, Markus Gewehr,
Wassilios Grammenos, Andreas Gypser,
Bernd Müller, Joachim Rheinheimer,
Peter Schäfer, Frank Schieweck, Anja
Schwögle, Jordi Tormo i Blasco,
John-Bryan Speakman, Michael Rack,
Reinhard Stierl, Maria Scherer,
Ulrich Schöfl and Siegfried Strathmann,

~ a quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y
quien(es) tiene(n) capacidad legal para otorgarlo

to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who ~~was~~ (have)
legal capacity to execute it



Notario Público Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

Urk R Nr 1154/2004

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

- 1 Mr Oliver **Wagner**, residing at Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Germany, personally known to me,
- 2 Mr Thomas **Grote**, residing at Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
- 3 Mr Carsten **Blettner**, residing at Richard-Wagner-Straße 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
- 4 Mr Markus **Gewehr**, residing at Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
- 5 Mr Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
- 6 Mr Andreas **Gypser**, residing at B 4, 4, 68159 Mannheim, Germany, personally known to me,
- 7 Mr Bernd **Müller**, residing at Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
- 8 Mr Joachim **Rheinheimer**, residing at Merziger Straße 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
- 9 Mr Peter **Schäfer**, residing at Römerstraße 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 **Schwögl**, residing at Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,

- 12 Mr Jordi **Tormo i Blasco**, residing at Carl-Benz-Straße 10-3, 69514 Laudenbach, , Germany, personally known to me,
- 13 Mr John-Bryan **Speakman**, residing at In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Germany, personally known to me,
- 14 Mr Michael **Rack**, residing at Sandwingert 67, 69123 Heidelberg, Germany, personally known to me,
- 15 Mr Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstraße 8, 67251 Freinsheim, Germany, personally known to me,
- 16 Mrs Maria **Scherer**, residing at Hermann-Jürgens-Straße 30, 76829 Landau, Germany, personally known to me,
- 17 Mr Ulrich **Schöfl**, residing at Erlenstr 8, 68782 Brühl, Germany, personally known to me,
- 18 Mr Siegfried **Strathmann**, residing at Donnersbergstraße 9, 67117 Limburgerhof, Germany, personally known to me,

are true and valid

Ludwigshafen/Rhine, this 3rd day of June, 2004



Notary Public

Wert 5 112,92 Euro

30

A P O S T I L L E

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

- 5 in Frankenthal (Pfalz)
- 6 am 23 Juni 2004
- 7 durch den Präsidenten des Landgerichts
- 8 unter Nr 91 Eb - 725-726/04

9 Siegel/Stempel

10 Unterschrift
Im Auftrag



(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk
Gebühr 12,-- €

TRADUCCION OFICIAL No 11919

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

- Oliver Wagner
Im Melsental 50, 67433 Neustadt, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Thomas Grote
domiciliado en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Carsten Blettner
domiciliado en Richard- Wagner-Str 48, 68165 Mannheim, 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
- Andreas Gypser
domiciliado en B 4 4, 68159 Mannheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Bernd Müller
domiciliado en Stockingerstr 7, 67227 Frankfurt, 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
- Peter Schäfer
domiciliado en Römerstr 1, 67308 Ottersheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Frank Schieweck
domiciliado en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCCION OFICIAL

Resolución No 599 Minjusticia

- Anja Schwöglér
domiciliada en Heinnch-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadana de Alemania
- Jordi Tormo i Blasco
domiciliado en Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania
Ciudadano de España
- Alan Akers
domiciliado en 120 Avenue de Strasbourg, 67170 Brumath, Francia
Ciudadano del Reino Unido
- John-Bryan Speakman
domiciliado en In den Handomen 7, 67273 Bobenheim, Alemania,
Ciudadano del Reino Unido
- Michael Rack
domiciliado en Sandwingert 67, 69123 Heidelberg, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Reinhard Sterl
domiciliado en Jahnstr 8, 67251 Freinsheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Mana Scherer
domiciliada en Hermann-Jürgens-Str 30, 76829 Godramstein, Alemania
Ciudadana de Alemania
- Ulrich Schöff
domiciliado en Erlenstr 8, 68782 Brühl, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Siegfried Strathmann,
domiciliado en Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof, Alemania,
Ciudadano de Alemania,

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

Pirazolopirimidinas sustituidas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Hay dieciocho firmas ilegibles. Dado y firmado el 03 de junio de 2004 en 67056 Ludwigshafen, Alemania

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA Y INTERPRETE OFICIAL

Resolución No 599 Minjusticia

Autenticación notarial en inglés de las dieciocho firmas antecedentes (individuo)
por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 3 de junio
2004 Fdo firma ilegible, sello notarial en tinta

Autenticación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de
Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 3 de junio 2004, bajo el No
1154/2004 (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 público
- 2 Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer
- 3 Actuando en calidad de notario público
- 4 Lleva el sello oficial del notario Draxel-Fischer,
notario de Ludwigshafen am Rhein

230624114231 30 3751
20 410009 30 3751
15 01 01 01 01 01
15 01 01 01 01 01
0101 100 0101 100 0101 100

Certificado

- 5 en Frankenthal (Pfalz)
- 6 el 23 de junio de 2004
- 7 por el Presidente del Tribunal Regional
- 8 bajo el No 91 Eb - 725-726/04
- 9 Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10 Firma
Fdo firma ilegible
(Christian König)
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, 16 de noviembre 2005
C 3458

LUZ ARRIAGA DE HEREDIA
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
[Firma]
Resolución No 559 Minjusticia

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

2005 NOV 18 P 12:21

DEPARTAMENTO DE LAS FUENTES
DE LAS FUENTES DE BOGOTÁ D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

189292

BOGOTÁ
DEPARTAMENTO DE LAS FUENTES
DE LAS FUENTES DE BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE
Pablo Mendez Barajas
CONCINCIA CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTAFE DE BOGOTA, 18 NOV 2005



34

TRADUCCIÓN OFICIAL No 11 17/05e realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia, registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento mediante el cual Oliver Wagner, Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania, ciudadano alemán, Thomas Grote, Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, ciudadano alemán, Carsten Blettner, Richard-Wagner-Str 48, 68165, Mannheim, Alemania, ciudadano alemán, Markus Gewehr, Goethestr 21, 56288 Kastellaun, Alemania, ciudadano alemán, Wassilios Grammenos, Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano griego, Andreas Gypser, B 4, 4, 68159 Mannheim, Alemania, ciudadano alemán, Bernd Müller, Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal, Alemania, ciudadano alemán, Joachim Rheinheimer, Merziger Str 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano alemán, Peter Schäfer, Römerstr 1, 67308 Ottersheim, Alemania, ciudadano alemán, Frank Schieweck, Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania, ciudadano alemán, Anja Schwögl, Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim, Alemania, ciudadano alemán, Jordi Tormo i Blasco, Carl-Benz-Str 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania, ciudadano español, Alan Akers, 120 Avenue de Strasbourg, 67170 Brumath, Francia, ciudadano del Reino Unido, John-Bryan Speakman, In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Alemania, ciudadano del Reino Unido, Michael Rack, Sandwingert 67, 69123 Heidelberg, Alemania, ciudadano alemán, Reinhard Stierl, Jahnstr 8, 67251 Freinsheim, Alemania, ciudadano alemán, Maria Scherer, Hermann-Jürgens-Str 30, 76829 Godramstein, Alemania, ciudadano alemán, Ulrich Schöfl, Erlenstr 8, 68782 Brühl, Alemania, ciudadano alemán, Siegfried Strathmann, Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, ciudadano alemán, declaran bajo juramento ser únicos y verdaderos inventores de la invención *"pirazolopirimidinas sustituidas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así*

1

35

como productos que la contienen" y declaran así mismo que ceden y transfieren sin limitación a favor de BASF Aktiengesellschaft, una sociedad constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania domiciliada en el 67056 Ludwigshafen, Alemania todos los derechos inherentes a dicha invención y que dicha Compañía queda facultada para solicitar a su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia

Dado y firmado el 03 de junio de 2004

Firmas ilegibles de los inventores mencionados anteriormente exceptuando la del señor Alan Akers

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (INDIVIDUO) del 3 de junio de 2004 por medio de la cual se autentican las firmas de Oliver Wagner, Thomas Grote, Carsten Blettner, Markus Gewehr, Wassilios Grammenos, Andreas Gypser, Bernd Müller, Joachim Rheinheimer, Peter Schäfer, Frank Schieweck, Anja Schwögl, Jordi Tormo i Blasco, John-Bryan Speakman, Michael Rack, Reinhard Stierl, Maria Scherer, Ulrich Schöfl y Siegfried Strathmann, en el anterior documento así como su capacidad legal otorgarlo

Firma Ilegible

Sello Notarial

Urk R Nr 1154/2004

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

1 El señor Oliver Wagner, domiciliado en Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania, a quién conozco personalmente,

2 El señor Thomas Grote, domiciliado en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

3 El señor Carsten Blettner, domiciliado en Richard-Wagner-Straße 48, 68165, Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

4 El señor Markus Gewehr, domiciliado en Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Alemania, a quién conozco personalmente,

5 El señor Wassilios Grammenos, domiciliado en Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, a quién conozco personalmente,

6 El señor Andreas Gypser, domiciliado en B 4, 4, 68159 Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

7 El señor Bernd Müller, domiciliado en Stockingerstr 7, 67227 Frankenthal, Alemania, a quién conozco personalmente,

8 El señor Joachim Rheinheimer, domiciliado en Merziger Straße 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, a quién conozco personalmente,

9 El señor Peter Schäfer, domiciliado en Römerstraße 1, 67308 Ottersheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

10 El señor Frank Schieweck, domiciliado en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

11 La señora Anja Schwogler, domiciliada en Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

12 El señor Jordi Tormo i Blasco, domiciliado en Carl-Benz-Straße 10-3, 69514 Laudendach, Alemania, a quién conozco personalmente,

13 El señor John-Bryan Speakman, domiciliado en In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

14 El señor Michael Rack, domiciliado en Sandwingert 67, 69123 Heidelberg, Alemania, a quién conozco personalmente,

32

15 El señor Reinhard Stierl, domiciliado en Jahnstraße 8, 67251 Freinsheim, Alemania, a quién conozco personalmente,

16 La señora Maria Scherer, domiciliada en Hermann-Jürgens-Straße 30, 76829 Landau, Alemania, a quién conozco personalmente,

17 El señor Ulrich Schöfl, domiciliado en Erlenstr 8, 68782 Brühl, Alemania, a quién conozco personalmente,

18 El señor Siegfried Strathmann, domiciliado en Donnersbergstraße 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, a quién conozco personalmente,

son auténticas y válidas

Ludwigshafen/Rhine, hoy 3 de Junio de 2004

Sello de
Oblea

Firma Ilegible
Notario Público

(Anexo)

Sello de Apostille expedido en la República Federal de Alemania y certificada el 23 de Junio de 2005 con el Nr 91 Kb - 725-726/04 ✓
firmado por Christian Köneke

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

DVZ//ID-007271/WPCL002G/COLO 00361-841-066-0

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

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

*Diego Felipe
Vargas Zuluaga*

COINCIDE(NI) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTA FE DE BOGOTA,

18 NOV 2005



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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



54619

030311

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
9 Dezember 2004 (09.12.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/106341 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷ C07D 487/04
A01N 43/90

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US) BASF AKTIENGESellschaft (DE/DE)
67056 Ludwigshafen (DE)

(21) Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/005694

(72) Erfinder, und

(22) Internationales Anmeldedatum
27 Mai 2004 (27.05.2004)

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US) WAGNER, Oliver [DE/DE] Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE). GROTE, Thomas [DE/DE] Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). BLETNER, Carsten [DE/DE] Richard Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE] Goethestr. 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE] Alexander-Fleming Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). GYPSE, Andreas [DE/DE] B 4.4, 68159 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE] Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]

(25) Einreichungssprache Deutsch

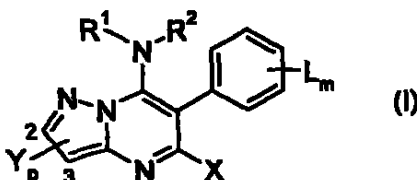
(26) Veröffentlichungssprache Deutsch

(30) Angaben zur Priorität
103 25 244.4 3 Juni 2003 (03.06.2003) DE
103 35 960.5 4 August 2003 (04.08.2003) DE
10 2004 005 910.1 5 Februar 2004 (05.02.2004) DE

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title SUBSTITUTED PYRAZOLOPYRIMIDINES METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF USE OF THE SAME FOR CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung SUBSTITUIERTE PYRAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) Abstract The invention relates to substituted pyrazolopyrimidines of formula (I) wherein the substituents have the following designations: L represents halogen, alkyl, halogenalkyl, alkenyl, alkoxy, amino, NHR, NR₂, cyano, S(=O)_n, A¹ or C(=O)A²; R representing alkyl or alkylcarbonyl; A¹ representing hydrogen, hydroxy, alkyl, alkylamino or dialkylamino; n representing 0, 1 or 2; and A² representing alkenyl, alkoxy, halogenalkoxy or one of the groups cited for A¹; m represents 0 or 1 to 5; R¹ represents alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, halogenocycloalkyl, alkenyl, alkadienyl, halogenalkenyl, cycloalkenyl, alkynyl, halogenalkynyl or cycloalkynyl; phenyl, naphthyl or a five membered to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle containing between one and four heteroatoms from the group O, N or S; and R² represents hydrogen or one of the groups cited for R¹. Together with the nitrogen atom to which they are bonded, R¹ and R² can form a five membered to six membered ring that can be interrupted by an atom from the groups O, N and S, and R¹ and/or R² can also be substituted according to the description. Furthermore, in formula (I), X represents halogen, cyano, OH, alkyl, alkoxy or halogenalkoxy; Y represents a five membered to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle according to the description, or a group X or another group according to the description; p represents 1 or 2, the groups Y being potentially different when p = 2; and p represents 0, when X is according to the description. The invention also relates to methods and intermediate products for producing said compounds, agents containing the same, and the use thereof for controlling phytopathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung Substituierte Pyrazolopyrimidine der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: L Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Alkoxy, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(=O)_n, A¹ oder C(=O)A²; R Alkyl oder Alkylcarbonyl; A¹ Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl, Alkylamino oder Dialkylamino; n 0, 1 oder 2; A² Alkenyl, Alkoxy, Halogenalkoxy oder eine der bei A¹ genannten Gruppen; m 0 oder 1 bis 5; R¹ Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenocycloalkyl, Alkenyl, Alkadienyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Cycloalkynyl; Phenyl, Naphthyl oder ein fünf bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; R² Wasserstoff oder eine der bei R¹ genannten Gruppen; R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein, wobei R¹ und/oder R² gemäß der Beschreibung substituiert sein können; X Halogen, Cyano, OH, Alkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy; Y fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus gemäß der Beschreibung, oder eine Gruppe X oder eine andere Gruppe gemäß der Beschreibung; p 1 oder 2, wobei die Gruppen Y verschieden sein können, wenn p = 2 ist; p 0, wenn X gemäß der Beschreibung; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2004/106341 A1

WER



Merziger Str 24 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE] Römerstr 1 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE] Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE] Heinrich-Lanz-Strasse 3 68165 Mannheim (DE). TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE] Carl-Benz-Str 10-3 69514 Laudenbach (DE). AKERS, Alno [GB/FR] 120 Avenue de Strasbourg, F-67170 Brünath (FR). SPEAKMAN, John Bryan [GB/DE] In den Hahndornen 7 67273 Bobenheim (DE). RACK, Michael [DE/DE] Sandwingert 67 69123 Heidelberg (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE] Jahnstr 8 67251 Freinsheim (DE). SCHERER, Maria [DE/DE] Hermann-Jürgens-Strasse 30 76829 Godesheim (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE] Erlenstr 8, 68782 Brühl (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE] Donnersbergstr 9 67117 Limburgerhof (DE).

FI GB GD GE, GH GM HR, HU ID IL, IN IS JP KE, KG KP KR, KZ, LC LK, LR, LS LT LU LV MA, MD MG MK, MN MW MX MZ, NA NI NO NZ, OM PG PH PL, PT RO RU SC, SD SE, SG SK, SL, SY TJ TM TN TR, TT TZ, UA UG US, UZ, VC VN YU ZA ZM ZW

(74) Gemeinsamer Vertreter BASF AKTIENGESSELLSCHAFT 67056 Ludwigshafen (DE)

Veröffentlicht.

— mit internationalem Recherchenbericht

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart) AE AG AL, AM AT AU AZ, BA BB BG, BR, BW BY BZ, CA CH CN CO CR CU CZ, DE, DK DM DZ, EC EE, EG, ES

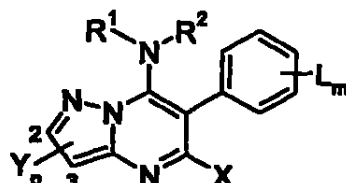
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Substituierte Pyrazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Pyrazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben

- 10 L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(=O)_nA¹ oder C(=O)A²,
- R C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl,
- 15 A¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino
- n 0, 1 oder 2,
- 20 A² C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy oder eine der bei A¹ genannten Gruppen,
- m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5,
- 25 R¹ C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₄-C₁₀-Alkadienyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl oder C₃-C₈-Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,
- 30 R² Wasserstoff oder eine der bei R¹ genannten Gruppen,
- R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl und Oxy-C₁-C₃-
- 35

alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C₁-C₄-Alkylkette verbunden sein können,

wobei R¹ und/oder R² durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein kann

5

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

10

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

15

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten,

20

25

und/oder einen bis drei der folgenden Reste

30

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

35

X Halogen, Cyano, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy,

40

- Y ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, oder eine der bei X genannten Gruppen, wobei diese Gruppen durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen Rⁿ substituiert sein können, Nitro, Amino, -CHO, -NHCO-NH-C₁-C₈-Alkyl, -NHCO-O-C₁-C₈-Alkyl, -CO-NH₂,
- 5
- p 1 oder 2, wobei die Gruppen Y verschieden sein können, wenn p = 2 ist;
- p O wenn die Gruppe X Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy ist.
- 10

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

- 15
- Aus US 4 567 263, WO 98/35890, US 5 817 663 sind Pyrazolopyrimidine allgemein bekannt. In WO 02/48151 sind 6-Phenyl-pyrazolopyrimidine offenbart, in denen die Phenylgruppe durch eine bis vier Gruppen substituiert ist. In EP-A 71 792 sind 7-Amino-Pyrazolopyrimidine beschrieben, die in 2- und/oder 3-Position substituiert sein können. Aus JP 2002-308878A und JP 2002-308879A sind in 2-Stellung substituierte Pyrazolopyrimidine bekannt. Die in den genannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.
- 20

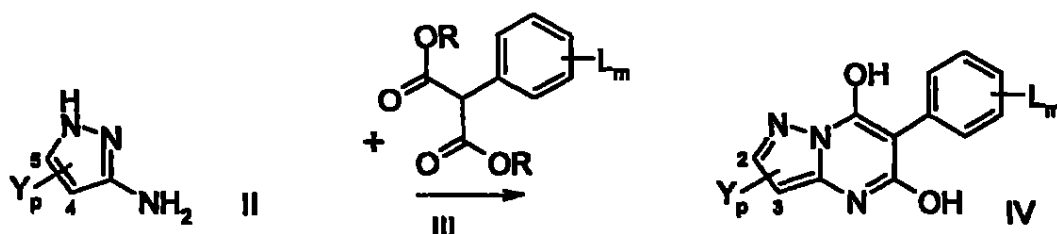
- 25
- Die Wirkung der bekannten Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

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

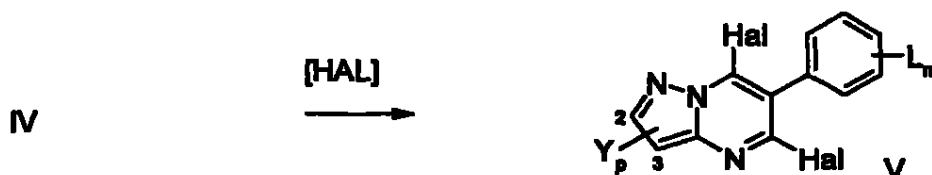
- 35
- Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den aus EP-A 71 792 bekannten Verbindungen durch die Substitution der 7-Aminogruppe, von den in WO 02/48151 beschriebenen durch die Substitution in der 2- und/oder 3-Position des Pyrazolopyrimidin-Gerüsts und von den aus JP 2002-308878A und JP 2002-308879A bekannten Verbindungen durch den Substituenten in der 5-Position.

- 40
- Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

- Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Allgemein werden sie ausgehend von substituierten Aminopyrazoldervaten II und 2-Phenylmalonaten III unter den aus WO 02/48151 bekannten Bedingungen erhalten. In Formel III steht R für eine C₁-C₄-Alkylgruppe, insbesondere für Methyl oder Ethyl. Pyrazole II sind zu T kommerziell erhältlich oder unter allgemein bekannten Bedingungen herstellbar. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen III erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 bekannten Bedingungen.



- Die so erhaltenen 5,7-Dihydroxy-6-phenylpyrazolopyrimidine IV werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] zu 7-Halogenopyrazolopyrimidinen der Formel V umgesetzt.



In Formeln IV und V entspricht die Definition der Variablen der für Formel I und „Hal“ steht für ein Halogenatom, bevorzugt für Brom oder Chlor.

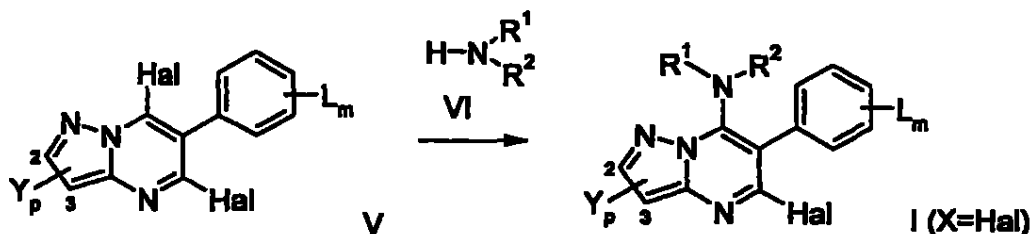
15

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

20

Aus den Verbindungen der Formel V werden durch Umsetzung mit Aminen der Formel VI Pyrazolopyrimidine der Formel I erhalten, in denen X Halogen bedeutet. Sie stellen einen bevorzugten Erfindungsgegenstand dar. Besonders bevorzugt werden Pyrazolopyrimidine, die eine Gruppe Y in 3-Stellung tragen.

25



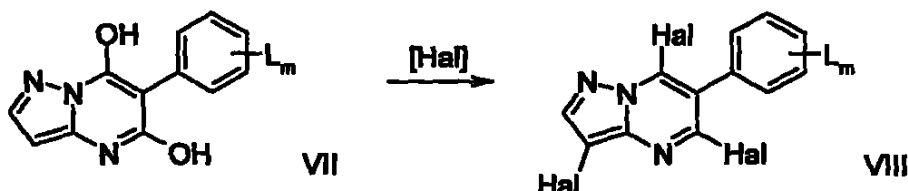
Die Umsetzung von V mit Aminen VI wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO 98/46608, WO 02/48151]

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

10

Vorteilhaft werden Verbindungen der Formel I, die eine Gruppe Y in 3-Stellung tragen, ausgehend von 5,7-Dihydroxypyrazolopyrimidinen VII durch Umsetzung mit einem Halogenierungsmittel erhalten. Die so zugänglichen Trihalogenpyrazolopyrimidine der Formel VIII sind wertvolle Zwischenprodukte zur Herstellung der Verbindungen der

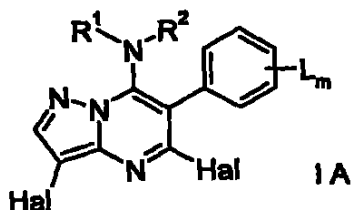
15 Formel I



In Formeln VII und VIII entspricht die Definition der Variablen der für Formel I und „Hal“ steht für ein Halogenatom, bevorzugt Brom oder Chlor. Die Halogenierung erfolgt analog der Verbindungen IV.

20

Aus den Verbindungen VIII können durch Kondensation mit Aminen VI unter den voranstehend beschriebenen Bedingungen die Verbindungen I A erhalten werden. Sie stellen einen besonders bevorzugten Erfindungsgegenstand dar. Verbindungen I A sind auch wertvolle Zwischenprodukte für die Herstellung weiterer Verbindungen I.

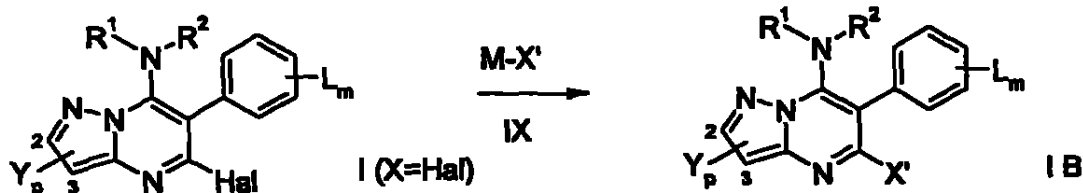


25

5,7-Dihydroxypyrazolopyrimidine der Formel II sind bekannt aus WO 02/48151. Amine der Formel VI sind z. T. bekannt, kommerziell verfügbar oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

30

Verbindungen I, in denen X in 5-Stellung für Cyano, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy (Formel I B) steht, können vorteilhaft ausgehend von Ausgangsstoffen der Formel I A auf den nachfolgend skizzierten Routen hergestellt werden

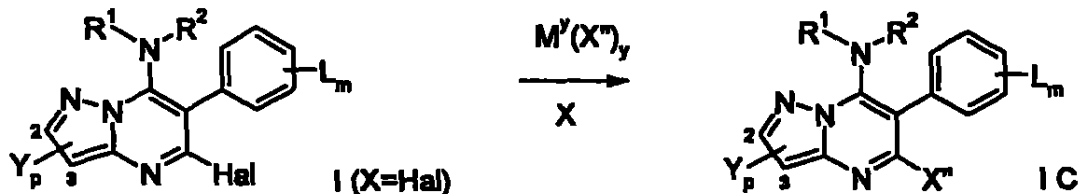


- 5 Verbindungen I (X=Hal) werden mit Verbindungen M-X' (Formel IX) zu Verbindungen I B umgesetzt. Verbindungen IX stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel IX hat geringe Bedeutung, aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt. Üblicherweise liegt die
- 10 Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd 12, S. 861-863 (1975)].

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

- 20 Verbindungen I, in denen X für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht (Formel I C), können vorteilhaft ausgehend von Verbindungen der Formel I, in denen X für Halogen steht, auf den nachfolgend skizzierten Routen hergestellt werden.

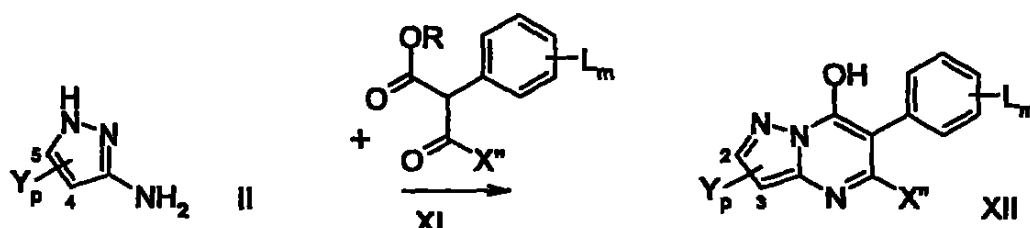
- 25 Verbindungen der Formel I C, in denen X' C₁-C₆-Alkyl bedeutet, können durch Kuppelung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV A, mit metallorganischen Reagenzien der Formel X erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



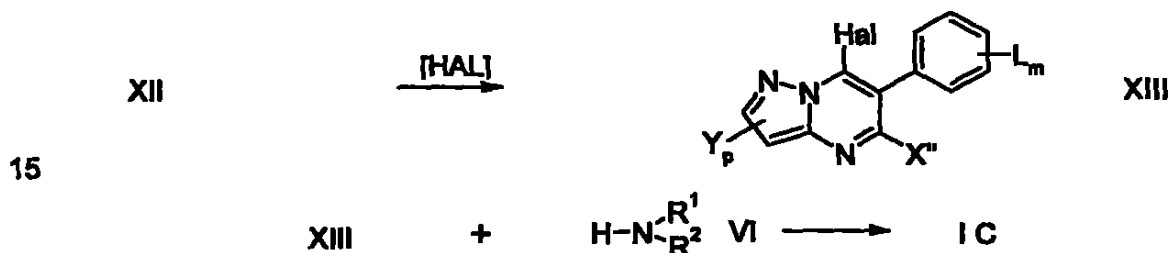
- 30 In Formel X steht X' für C₁-C₆-Alkyl und M' für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996), WO 99/41255, Aust. J. Chem., Bd. 43, S. 733 (1990), J. Org. Chem., Bd. 43, S. 358 (1978), J. Chem. Soc. Chem. Commun. S. 866 (1979), Tetrahedron Lett., Bd. 34, S. 8267 (1993), ebenda, Bd. 33, S. 413 (1992).

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

- 5 Ausgehend von substituierten Aminopyrazolidenvaten II und Ketoestern XI werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenylpyrazolopyrimidine XII erhalten. In Formel XI steht R für eine C₁-C₄-Alkylgruppe, insbesondere für Methyl oder Ethyl und X'' für C₁-C₄-Alkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern XIa mit X''=CH₃ werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenylpyrazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen XI erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 bekannten Bedingungen.

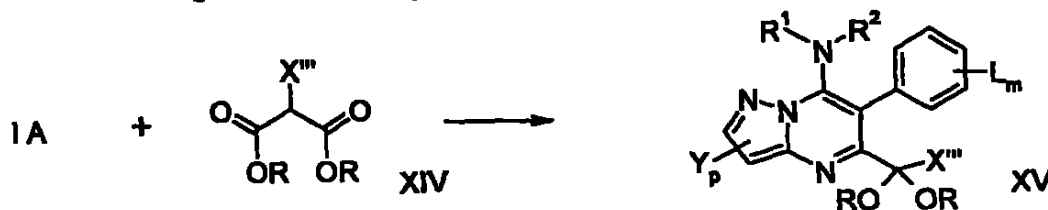


Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenylpyrazolopyrimidine XII werden analog der Verbindungen IV mit Halogenierungsmitteln [HAL] zu 7-Halogenopyrazolopyrimidinen der Formel XIII umgesetzt.



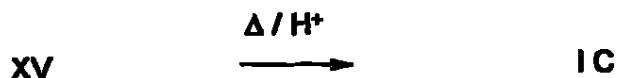
Die Umsetzung von XIII mit Aminen VI erfolgt analog der Umsetzung der Verbindungen V mit VI.

- 20 Verbindungen der Formel I C, können alternativ auch aus Verbindungen I A und Malonaten der Formel XIV hergestellt werden. In Formel XIV bedeuten X''' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel XV umgesetzt und zu Verbindungen I C decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].



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

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



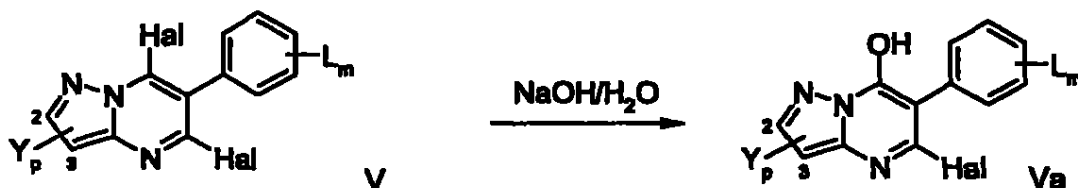
Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure

10

Verbindungen der Formel I, in denen X für CN oder C₁-C₄-Alkoxy steht (Formel I D) können auf folgendem Syntheseweg erhalten werden

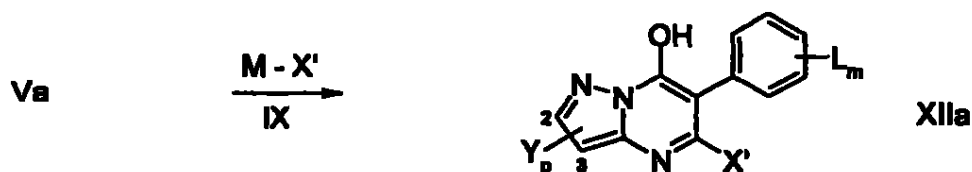
5,7-Dihalogenopyrazolopyrimidine der Formel V werden durch selektive Hydrolyse in 5-Halogeno-7-hydroxypyrazolopyrimidine der Formel Va überführt in Analogie zu Chem Pharm Bull, 1961, 9,801 (Triazolopyrimidine) oder J Agnc Food Chem 41, 12, 1993, 2411 (Pyrimidine) oder sauer katalysiert mit 10 %iger HCl in Dioxan gemäß Khim Geterotsiki Soedin, RU, 21, 3, 1985, 378 (Pyrimidine)

20

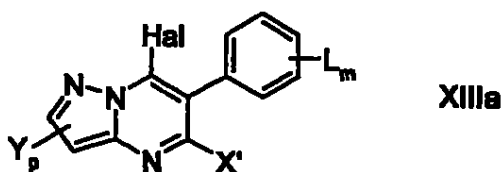


Die so gewonnenen 5-Halogeno-7-hydroxypyrazolopyrimidine Va werden mit metallorganischen Reagenzien der Formel IX zu den Verbindungen XIIa umgesetzt

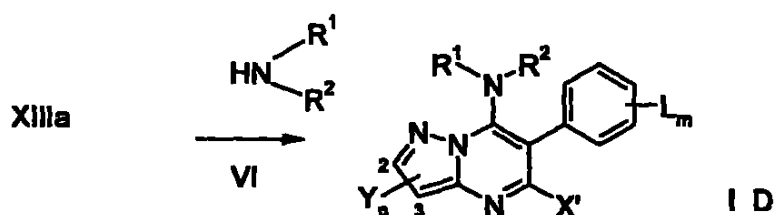
25



wenn X' für CN oder C₁-C₄-Alkoxy steht, gefolgt von Halogenierung von XIIa zu Verbindungen der Formel XIIIa



und Umsetzung von XIIIa mit Aminen der Formel VI zu Verbindungen der Formel I D in Analogie zur Herstellung der Verbindung I.A.



5

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

10

15

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

20

25

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

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schädling erfolgen.

30

35

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_4 -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-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl,

15 Halogenalkyl geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können insbesondere C_1 - C_2 -Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl,

25 Alkenyl ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C_2 - C_6 -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-bu-

24

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

- 5 Halogenalkenyl ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger 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,

10

Alkynyl geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C_2-C_8 -Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl,

15

20

- 25 Cycloalkyl mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C_3-C_8 -Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl,

fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyc-
lus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S

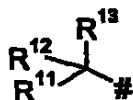
- 30 - 5- oder 6-gliedriges gesättigtes Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isioxazolidinyl, 4-Isioxazolidinyl, 5-Isioxazolidinyl, 3-Isiothiazolidinyl, 4-Isiothiazolidinyl, 5-Isiothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Pipendinyl, 3-Pipendinyl, 4-Pipendinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyran-yl, 4-Tetrahydropyran-yl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidin-yl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl,

40

- 5- oder 6-gliedriges partiell ungesättigtes Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 3,6-Dihydro-2H-pyridin-1-yl und 2,5-Dihydro-pyrrrol-1-yl
- 5 - 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-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl,
- 10 - 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-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl,
- 15 Alkylen divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH₂-Gruppen, z.B. CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂,
- 20 Oxyalkylen divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂,
- 25 Oxyalkylenoxy divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O,
- 30 In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Racemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen
- 35 Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L_m, R¹, R², X und Y_p der Formel I
- Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Pyrazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt
- 40

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht

- Verbindungen I sind besonders bevorzugt, in denen R¹ für eine Alkenyl- oder Alkynyl-
 5 gruppe steht, die am α-C-Atom eine Verzweigung aufweist. In diesen Fällen entspricht die Gruppe R¹ einer Gruppe A



A

in der # die Bindung zu dem Stickstoffatom darstellt und

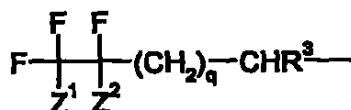
- 10 R¹¹ C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl,
 R¹² Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl,
 R¹³ C₂-C₁₀-Alkenyl oder C₂-C₈-Alkynyl, wobei R¹³ unsubstituiert oder partiell oder
 vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann,
 bedeuten

15

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für einen 5- oder 6-
 gliedrigen gesättigten oder aromatischen Heterocyclus enthaltend ein oder zwei Hete-
 roatome aus der Gruppe N, O und S steht, der durch eine oder zwei Alkyl- oder Halo-
 genalkylgruppen substituiert sein kann

20

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R¹ für eine Gruppe B steht



B

worin

- 25 Z¹ Wasserstoff, Fluor oder C₁-C₈-Fluoroalkyl,
 Z² Wasserstoff oder Fluor, oder
 Z¹ und Z² bilden gemeinsam eine Doppelbindung,
 q 0 oder 1 ist, und
 R³ Wasserstoff oder Methyl bedeuten

30

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₈-Cycloalkyl steht,
 welches durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² Wasserstoff bedeutet

35

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für Methyl oder Ethyl steht

Sofern R^1 und/oder R^2 Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R^1 oder R^2 sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt

5

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl und Oxy- C_1 - C_6 -alkylenoxy tragen kann oder in dem zwei benachbarte Ringglieder durch eine C_1 - C_4 -Alkylenkette verbunden sein können

10

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pipendinyl-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Pipendinyling, der ggf durch eine bis drei Gruppen Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl, insbesondere durch 4-Methyl substituiert ist.

15

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist

20

Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen mindestens eine Gruppe L orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Pyrazolopyrimidin-Gerüst steht, insbesondere solche, in denen n den Wert 1, 2 oder 3 aufweist.

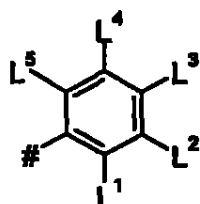
25

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen L_m Halogen, Methyl, Ethyl, C_1 -Halogenalkyl, Methoxy oder $-C(=O)-A^2$, worin A^2 Wasserstoff, Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_2 -Alkylamino oder Di- C_1 - C_2 -alkylamino bedeutet.

30

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

35



C

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

- L¹ Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃,
 L², L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor,
 L³ Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH₃, OCH₃ oder COOCH₃, und
 L⁵ Wasserstoff, Fluor oder CH₃ bedeuten

5

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen X Halogen, CN, OH, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy bedeuten

10

Weiterhin bevorzugt sind Verbindungen I, in denen X Halogen, CN oder C₁-C₄-Alkyl bedeuten

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

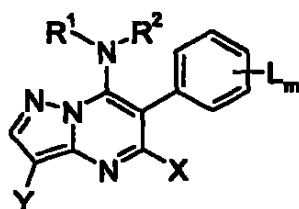
15

Daneben sind Verbindungen I bevorzugt, in denen Y für Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, oder Alkyl, insbesondere Methyl steht. In einer besonders bevorzugten Ausgestaltung der Erfindung ist die Gruppe X ein Chloratom, und Y steht für Fluor, Chlor oder Methyl

20

Weiterhin sind Verbindungen I bevorzugt, in denen der Index p = 1 ist.

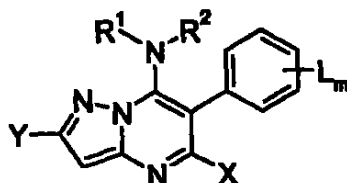
Daneben sind Verbindungen I bevorzugt, in denen die Gruppe Y in 3-Stellung des Pyrimidin-Gerüsts steht (Formel I 1)



I 1

25

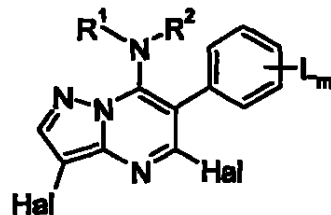
In einer anderen bevorzugten Ausgestaltung der Erfindung steht die Gruppe Y in 2-Stellung des Pyrimidin-Gerüsts (Formel I 2)



I 2

Verbindungen der Formel I A sind ein besonders bevorzugter Erfindungsgegenstand

16



IA

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

Tabelle 1

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

Tabelle 2

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

Tabelle 3

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

Tabelle 4

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

Tabelle 5

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

Tabelle 6

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

27

Tabelle 7

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

5

Tabelle 8

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

10

Tabelle 9

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

15

Tabelle 10

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

20

Tabelle 11

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

25

Tabelle 12

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

30

Tabelle 13

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

35

Tabelle 14

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

40

Tabelle 15

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2-Chlor-4-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 16

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2,3-Difluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2,5-Difluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 18

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2,3,4-Trifluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 19

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2-Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 20

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2,4-Dimethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 21

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2-Methyl-4-chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 22

Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L_m 2-Fluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

	Tabelle 23
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2,6-Dimethyl bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
5	
	Tabelle 24
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2,4,6-Trimethyl bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
10	
	Tabelle 25
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2,6-Difluor-4-cyano bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
15	
	Tabelle 26
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2,6-Difluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
20	
	Tabelle 27
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
25	
	Tabelle 28
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2-Trifluormethyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
30	
	Tabelle 29
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2-Trifluormethyl-5-fluor bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
35	
	Tabelle 30
	Verbindungen der Formel I 1, in denen X und Y Chlor, L _m 2-Trifluormethyl-5-chlor bedeuten und die Kombination von R ¹ und R ² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
40	

Tabelle 31

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

5

Tabelle 32

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

10

Tabelle 33

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

15

Tabelle 34

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

20

Tabelle 35

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

25

Tabelle 36

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

30

Tabelle 37

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

35

Tabelle 38

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

40

49

Tabelle 39

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 40

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Methoxy-6-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 41

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 42

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 43

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2,4-Difluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 44

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Fluor-4-chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 45

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Chlor-4-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 46

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2,3-Difluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 47

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

5

Tabelle 48

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

10

Tabelle 49

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

15

Tabelle 50

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

20

Tabelle 51

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

25

Tabelle 52

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

30

Tabelle 53

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

35

Tabelle 54

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

40

Tabelle 55

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-cyano bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 56

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 57

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 58

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Trifluormethyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 59

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 60

Verbindungen der Formel I 2, in denen X Chlor, Y Methyl, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 61

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Fluor-6-chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 62

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Difluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 63

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Dichlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 64

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Fluor-6-methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 65

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,4,6-Trifluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 66

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Difluor-4-methoxy bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 67

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m Pentafluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 68

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Methyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 69

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 70

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Methoxy-6-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 71

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

5

Tabelle 72

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

10

Tabelle 73

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

15

Tabelle 74

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

20

Tabelle 75

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

25

Tabelle 76

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

30

Tabelle 77

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

35

Tabelle 78

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

40

Tabelle 79

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 80

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,4-Dimethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 81

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Methyl-4-chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 82

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Fluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 83

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Dimethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 84

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,4,6-Trimethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 85

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Difluor-4-cyano bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 86

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Difluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 87

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 88

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Trifluormethyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 89

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 90

Verbindungen der Formel I 3, in denen X Methy, Y Wasserstoff, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle A

Nr	R ¹	R ²
A-1	CH ₃	H
A-2	CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	H
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₂ CF ₃	H
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-8	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-9	CH ₂ CCl ₃	H
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-11	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-16	CH(CH ₃) ₂	H
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₃

Nr	R ¹	R ²
A-18	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-20	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-21	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-22	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-24	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-28	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-29	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-30	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-33	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-42	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-48	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃

Nr	R ¹	R ²
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-66	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-72	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-77	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-78	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-79	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-80	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-81	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-82	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-83	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-84	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-85	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-86	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-87	CH ₂ -C≡CH	H
A-88	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-89	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-90	Cyclopentyl	H
A-91	Cyclopentyl	CH ₃
A-92	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-93	Cyclohexyl	H

Nr	R ¹	R ²
A-94	Cyclohexyl	CH ₃
A-95	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-96	CH ₂ -C ₆ H ₅	H
A-97	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃
A-98	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-99	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-100	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-101	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-102	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-103	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-104	-CH ₂ CHF(CH ₂) ₃ -	
A-105	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-106	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-107	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-108	-(CH ₂) ₅ -	
A-109	-(CH ₂) ₄ -	
A-110	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-111	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-112	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-113	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-114	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-115	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	
A-116	-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-117	-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-118	-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -	
A-119	-(CH ₂)-CH=CH-(CH ₂) ₂ -	
A-120	-(CH ₂) ₅ -	
A-121	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -	
A-122	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-123	-N=CH-CH=CH-	
A-124	-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-	
A-125	-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-	

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

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

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- 10 • *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- 15 • *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- 20 • *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Ucinula necator* an Reben,
- 25 • *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-*
cilomyces varioti im Materialschutz (z B Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
 30 Fasern bzw Gewebe) und im Vorratsschutz

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

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
5 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
10 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

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

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

- 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,
- 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 Naphthalindervaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd,
35 Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolygly-
40

koether, Alkyl-aryl-polyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypolypropylen, Laurylalkoholpoly-glykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht

5

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeöle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol,

10 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

15 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 Kieselgels, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, 20 Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere 25 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) 30 eingesetzt

Beispiele für Formulierungen sind 1 Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

35 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)

40 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

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

- 5 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

D Emulsionen (EW, EO)

- 10 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

15

E Suspensionen (SC, OD)

- 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

20

F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

- 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

25

G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

- 30 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs

35

2 Produkte für die Direktapplikation

H Stäube (DP)

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

40

I Granulate (GR, FG, GG, MG)

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.

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.

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.

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

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

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

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

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

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

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Amindenvate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tndemorph,
- Anilinopyrimidine wie Pymethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- 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, Tradimenol, Triflumizol, Trifconazol,
- Dicarboxamide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuanmol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Siltiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Trifonone,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenyldenvate, 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, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid

- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph

5

Synthesebeispiele

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

10

Beispiel 1 2-Methyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-5,7-diol [I-1]

- 15 Eine Mischung von 3 g (10,3 mmol) 2-(2,4,6-trifluorphenyl)malonsäurediethylester, 1 g (10,3 mmol) 3-Amino-5-methylpyrazol und 2,11 g (11,4 mmol) *t*-Butylamin wurden 5 Std. bei 140°C gerührt, wobei das entstehende Ethanol abdestilliert. Nach dem Abkühlen auf 20-25°C wurde mit ca. 10%-iger NaOH-Lösung versetzt. Die Mischung wurde mit Methyl-*tert.*-butylether (MTBE) extrahiert und die wässrige Phase mit verd. HCl-Lösung angesäuert. Die daraus ausgefallenen Kristalle wurden abfiltriert und getrocknet. Es wurden 3 g der Titelverbindung vom Fp. 304°C erhalten.

20

Beispiel 2 3,5,7-Trichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin [II-1]

- 25 3,0 g (10,7 mmol) 6-(2,4,6-Trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-5,7-diol (vgl. WO 02/48151), 2,22 g (10,7 mmol) Phosphorpentachlorid, 9,72 g (42,6 mmol) Benzyltriethylammoniumchlorid wurden in einer Lösung von 40 ml Phosphorylchlorid und 35 ml Acetonitril 20 Std. refluxiert. Nach Abkühlen wurde die Reaktionsmischung von flüchtigen Bestandteilen befreit und der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen. Die Lösung wurde auf Eiswasser gegeben und mit Natriumcarbonat-Lösung neutralisiert. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan-Essigester-Gemische) 0,5 g der Titelverbindung vom Fp. 128°C erhalten.

30

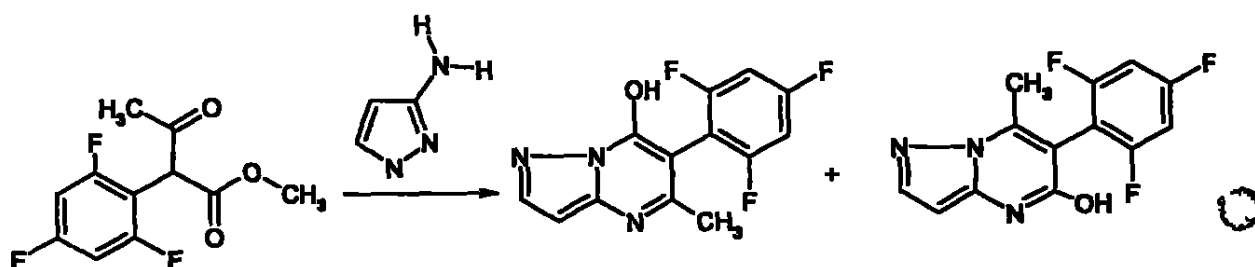
Beispiel 3 3,5-Dichlor-7-(4-methyl-pipendin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin [III-1]

- 40 Eine Lösung von 0,1 g (0,284 mmol) 3,5,7-Trichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin (Bsp. 2), 0,03 g (0,284 mmol) 4-Methylpipendin und 0,03 g *t*-Nethylamin in 1 ml Dichlormethan wurden bei 20-25°C etwa 4 Std. gerührt. Nach Zugabe von Wasser

und Phasentrennung wurde die organische Phase mit verd. HCl-Lösung und Wasser gewaschen, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand wurden 0,102 mg der Titelverbindung vom Fp 138°C erhalten

5 Beispiel 4 5-Methyl-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrazolo[1,5a]pyrimidin

Stufe a 5-Methyl-6-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrazolo[1,5a]pyrimidin-7-ol



10

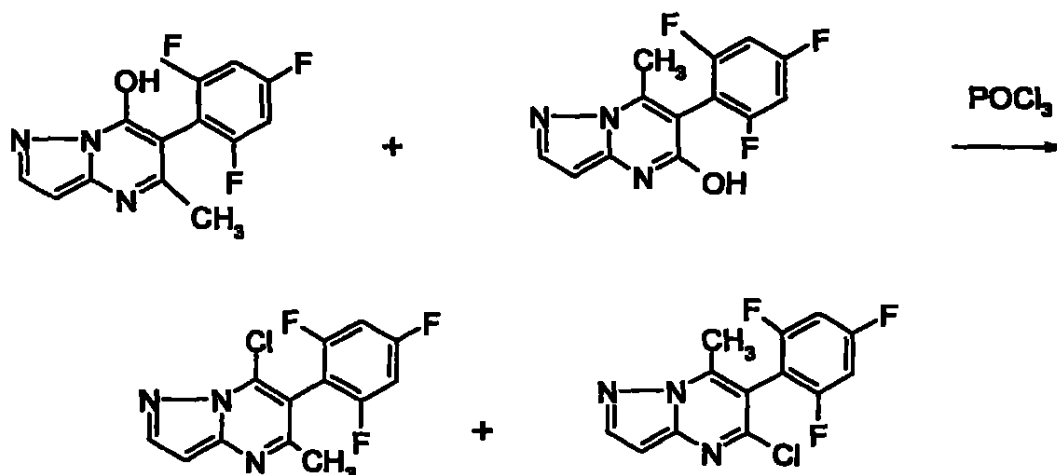
15 %

85 %

Eine Mischung von 2 g (0,0081 mol) 3-Oxo-2-(2,4,6-trifluorophenyl)butansäuremethylester, 0,68 g (0,0081 mol) 3-Aminopyrazol und 1,66 g (0,0089 mol) Tributylamin wurden 4 Stunden bei 160°C gerührt, wobei das entstehende Methanol abdestilliert. Nach dem Abkühlen wurde mit 10 %-iger Natriumhydroxidlösung versetzt. Die Mischung wurde mit Methyl-tert-butylether extrahiert und die wässrige Phase mit verdünnter Salzsäure angesäuert. Die daraus ausgefallenen Kristalle wurden abfiltriert und getrocknet. Es wurden 1,9 g eines Isomerengemisches erhalten, welches zu 15 % aus der Titelverbindung und 85 % aus 7-Methyl-6-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrazolo[1,5a]pyrimidin-5-ol besteht. Das Isomerengemisch wurde ohne Aufreinigung weiter umgesetzt.

20

Stufe b 7-Chloro-5-methyl-6-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrazolo[1,5a]pyrimidin

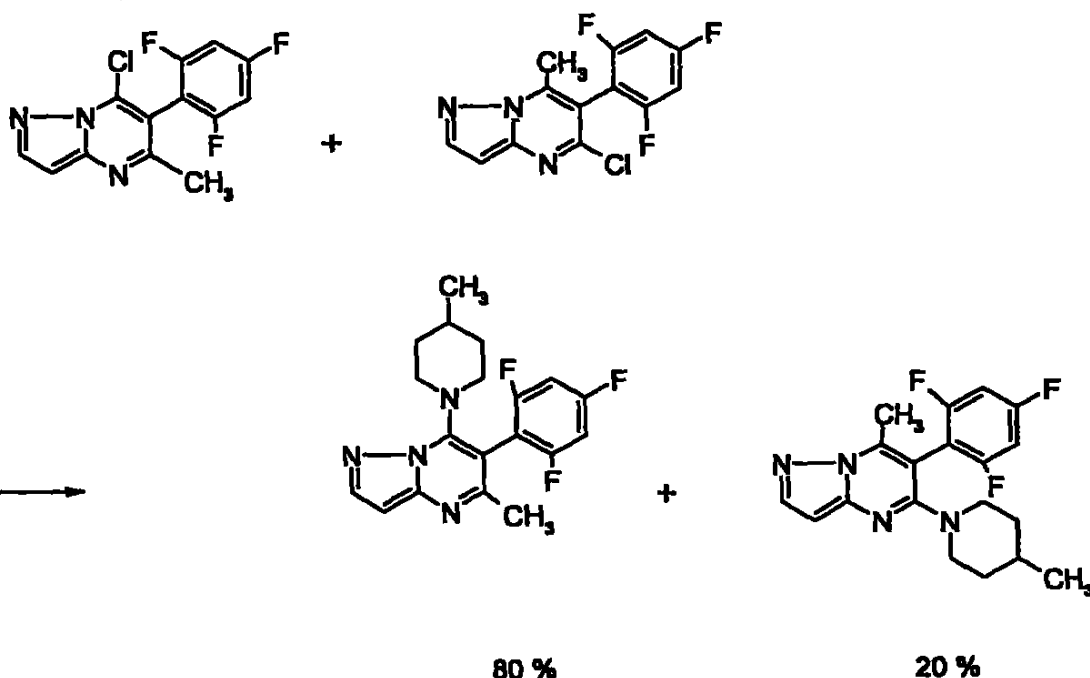


2,8 g (0,01 mol) des oben erhaltenen Isomerengemisch wurden in 10 ml Phosphor-
 oxychlorid 6 Stunden refluxiert. Nach Abkühlen wurde das Reaktionsgemisch vorsichtig
 auf Eiswasser gegeben, mit Natriumcarbonat-Lösung auf pH 7-8 gestellt, zweimal mit
 Essigester extrahiert und die vereinigten organischen Phasen getrocknet. Nach dem
 5 Einengen wurden 2,6 g des Isomerengemisches erhalten, welches die Titelverbindung
 in ca. 15 %-igem Anteil enthielt.

Nach einer Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester-Gemische) wurden
 400 mg eines Isomerengemisches erhalten, welches die Titelverbindung zu ca. 80-%
 enthielt.

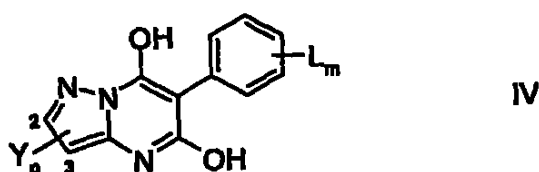
10

Stufe c 5-Methyl-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrazolo[1,5a]
 pyrimidin



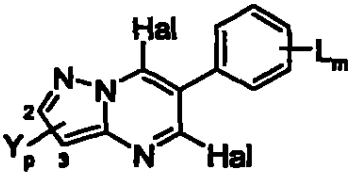
15 0,4 g des oben erhaltenen Isomerengemisches (0,0013 mol) und 0,25 g (0,0025 mol) 4-
 Methylpiperidin wurden bei 40°C 4 Stunden und 12 h bei Raumtemperatur geführt. Die
 Reaktionsmischung wurde in Essigester aufgenommen, zweimal mit 5%-iger Salzsäure
 und anschließend mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingedunstet. Der Rückstand
 wurde chromatographiert und es wurde 0,176 g eines Isomerengemisches erhalten,
 20 welches die Titelverbindung 80 %-ig enthielt.

Tabelle I – Zwischenprodukte der Formel IV



Nr	Y _p	L _m	phys. Daten (Fp [°C])
I-1	2-CH ₃	2,4,6-F ₃	304
I-2	2,3-(CH ₃) ₂	2,4,6-F ₃	375 (Zers)
I-3	3-CN	2,4,6-F ₃	241

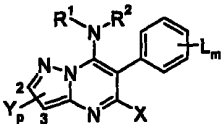
Tabelle II – Zwischenprodukte der Formel V



V

Nr	Y _p	Hal	L _m	phys. Daten (Fp. [°C])
II-1	3-Cl	Cl	2,4,6-F ₃	128
II-2	2-CH ₃ , 3-Cl	Cl	2,4,6-F ₃	184
II-3	2-CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	Öl
II-4	2,3 CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	Öl

αTabelle III – Verbindungen der Formel I



Nr	Y _p	R ¹	R ²	X	L _m	phys. Daten (Fp [°C])
III-1	3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	138
III-2	2-CH ₃ -3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	135
III-3	2-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	185
III-4	2-CH ₃	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -		Cl	2,4,6-F ₃	163
III-5	2-CH ₃ -3-Cl	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -		Cl	2,4,6-F ₃	152
III-6	3-Cl	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -		Cl	2,4,6-F ₃	69 (Zers.)
III-7	2,3-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	Ol
III-8	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	8,08 *
III-9 Isomer A	3-CN	(CH ₃) ₂ CHCH(CH ₃)-	H	Cl	2,4,6-F ₃	8 23 *
III-10 Isomer B	3-CN	(CH ₃) ₂ CHCH(CH ₃)-	H	Cl	2,4,6-F ₃	8 24 *
III-11 Isomer A	3-CN	(CH ₃) ₃ CH(CH ₃)-	H	Cl	2,4,6-F ₃	8 24 *
III-12 Isomer B	3-CN	(CH ₃) ₃ CH(CH ₃)-	H	Cl	2,4,6-F ₃	8 23 *

WO 2004/06341

41

PCT/EP2004/005694

57

Nr	Y _p	R ¹	R ²	X	L _m	phys Daten (Fp. [°C])
III-13	3-CN	CH ₃ CH ₂ -	CH ₃ CH ₂ -	Cl	2,4,6-F ₃	8 31 *
III-14	3-CN	CH ₂ C(CH ₃)CH ₂ -	CH ₃ CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	8 35 *
III-15	3-CN	(CH ₃) ₂ CH-	H	Cl	2,4,6-F ₃	148
III-16	3-CN	CH ₃ CH ₂ CH(CH ₃)-	H	Cl	2,4,6-F ₃	119
III-17	3-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	153
III-18	3-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OH	2,4,6-F ₃	234
III-19	3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CN	2,4,6-F ₃	7,9 *
III-20	3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	2,4,6-F ₃	8,13 *
III-21	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	2,4,6-F ₃	8,62 *
III-22	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CN	2,4,6-F ₃	150
III-23	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₃	2,4,6-F ₃	8,27 *

* ¹H-NMR(CDCl₃) 1H(H-2)

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

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

5

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

10

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

- 15 Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die $1,7 \times 10^8$ Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomazlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die
- 20 Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

- 25 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe III-1, bzw. III-6 der Tabelle III höchstens 7 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

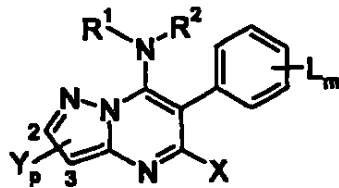
Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen Mehltau an Gurkenblättern verursacht durch *Sphaerotheca fuliginea* bei protektiver Anwendung

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

- 40 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe III-1, bzw. III-6 der Tabelle III keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Patentansprüche

1 Substituierte Pyrazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben

L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(=O)_nA¹ oder C(=O)A²,

10

R C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl,

A¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino

15

n 0, 1 oder 2,

A² C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy oder eine der bei A¹ genannten Gruppen,

20

m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5,

R¹ C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₄-C₁₀-Alkadienyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl oder C₃-C₈-Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

25

30 R² Wasserstoff oder eine der bei R¹ genannten Gruppen,

R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C₁-C₄-Alkylkette verbunden sein können,

35

wobei R¹ und/oder R² durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein kann

5 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter,
10 partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclius, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

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

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkyl-
20 amino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder
25 Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten,

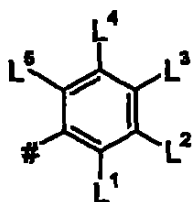
und/oder einen bis drei der folgenden Reste

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

X Halogen, Cyano, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy,
40

- Y ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, oder eine der bei X genannten Gruppen, wobei diese Gruppen durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein können, Nitro, Amino, -CHO, -NHCO-NH-C₁-C₈-Alkyl, -NHCO-O-C₁-C₈-Alkyl, -CO-NH₂,
- p 1 oder 2, wobei die Gruppen Y verschieden sein können, wenn p = 2 ist;
p 0 wenn die Gruppe X Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy ist
- 2 Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Halogen, CN, OH, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy bedeutet
- 3 Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Halogen, CN oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet.
- 4 Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Halogen oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet.
- 5 Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Halogen bedeutet
- 6 Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R¹ und R² folgende Bedeutung haben
- R¹ C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, und
- R² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, oder
- R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der einen oder zwei Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₈-Alkyl und C₁-C₈-Halogenalkyl tragen kann
- 7 Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für die Gruppe C

47



C

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

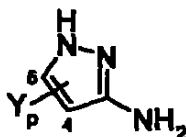
L¹ Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃,

L², L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor,

5 L³ Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH₃, OCH₃ oder COOCH₃, und

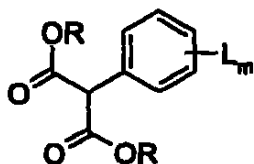
L⁵ Wasserstoff, Fluor oder CH₃ bedeuten

- 8 Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen X für Halogen steht, durch Umsetzung von substituierten 3-Aminopyrazol-
- 10 derivaten der Formel II, in der Y_p wie für Formel I gemäß Anspruch 1 definiert ist,



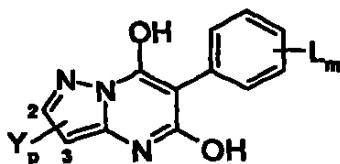
II

und 2-Phenylmalonaten III



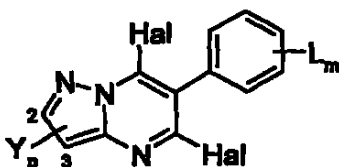
III

zu Dihydroxypyrazolopyrimidinen IV,



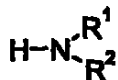
IV

15 Halogenierung von IV zu Halogenpyrazolopyrimidinen V



V

und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI

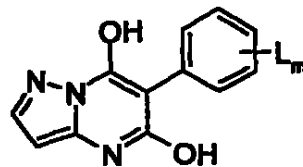


VI

20

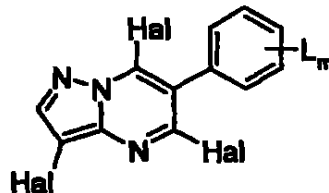
- 9 Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen die Gruppen X und Y Halogen bedeuten und Y in 3-Stellung des Pyra-

zolopyrimidin-Gerüsts steht, durch Halogenierung von Verbindungen der Formel VII



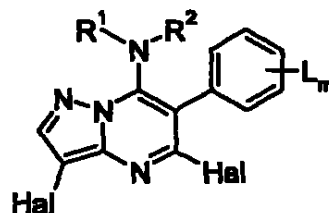
VII

- 5 in der die Variablen die für Formel I gegebene Bedeutung haben und Hal für ein Halogenatom steht, zu Tnhalogenpyrazolopyrimidinen der Formel VIII



VIII

und Umsetzung von VIII mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 5 zu Verbindungen der Formel I A



I A

10

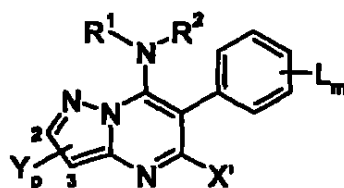
- 10 Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen X für Cyano, C₁-C₈-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von Halogenpyrazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel IX

15



IX

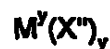
in der X' Cyano, C₁-C₈-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy bedeutet und M ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallkation ist, zu Verbindungen der Formel I B



I B

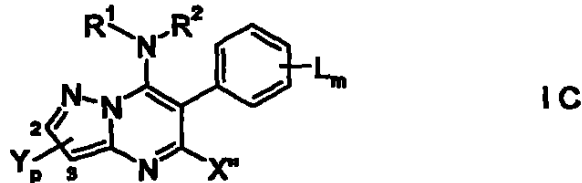
20

- 11 Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen X C₁-C₄-Alkyl bedeutet, durch Umsetzung von Halogenpyrazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel X



X

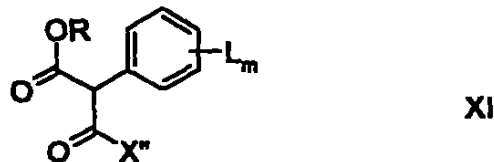
in der X^a für eine C₁-C₄-Alkylgruppe und M für ein Metallion der Wertigkeit Y, insbesondere B, Zn oder Sn steht, zu Verbindungen der Formel I C



5

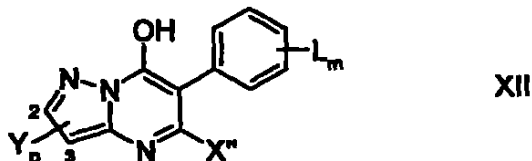
in der X^a für C₁-C₄-Alkyl steht, unter Übergangsmetallkatalyse, in einem inerten Lösungs- oder Verdünnungsmittel

- 12 Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C₁-C₄-Alkyl steht, durch Umsetzung von substituierten 3-Aminopyrazolen der Formel II gemäß Anspruch 5 mit Ketoestern der Formel XI,

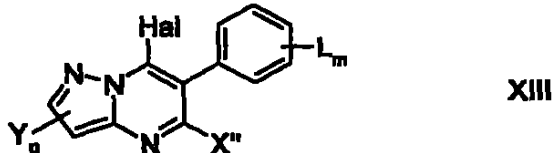


10

in der R für eine C₁-C₄-Alkylgruppe und X^a für C₁-C₄-Alkyl steht, zu Hydroxypyrazolopyrimidinen der Formel XII



und Halogenierung von XII zu Verbindungen der Formel XIII,

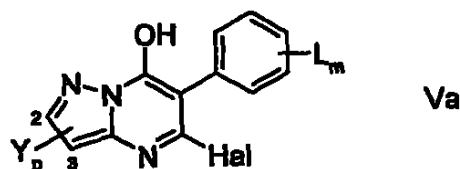


15

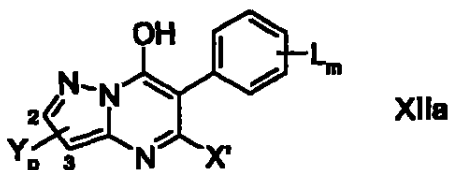
Umsetzung von XIII mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 5 zu Verbindungen der Formel I, in der X für C₁-C₄-Alkyl steht

20

- 13 Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für CN oder C₁-C₄-Alkoxy steht, durch partielle Hydrolyse der 5,7-Dihalogenpyrazolopyrimidine der Formel V gemäß Anspruch 5 mit wässriger Natronlauge zu 5-Halogen-7-hydroxypyrazolopyrimidine Va

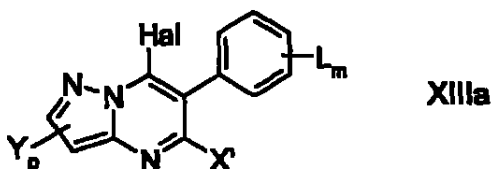


Umsetzung von Va mit metallorganischen Verbindungen der Formel IX gemäß Anspruch 10 zu den Verbindungen der Formel XII a



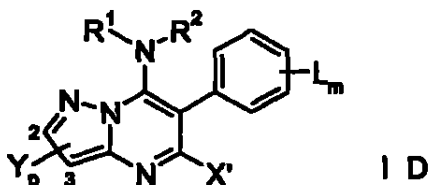
5

worin X' für CN oder C₁-C₄-Alkoxy steht und M die in Anspruch 10 angegebene Bedeutung hat, gefolgt von Halogenierung von XIIa zu Verbindungen der Formel XIIIa



10

und Umsetzung der Verbindungen der Formel XIIIa mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 8 zu Verbindungen der Formel I D



15

14 Zwischenprodukte der Formeln IV, V, Va, VIII, XII, XIIa, XIII und XIIIa gemäß den Ansprüchen 8, 9, 12 und 13

20 15 Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1

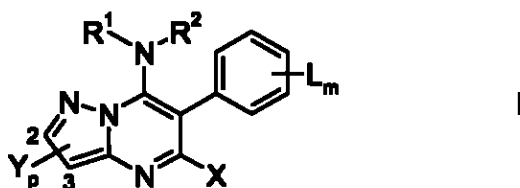
16 Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

25

Pirazolopirimidinas sustituidas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

Descripción

La presente invención se refiere a pirazolopirimidinas sustituidas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes

L significa, independientemente, halógeno, alquilo C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, alcoxi, amino C₁-C₈, NHR, NR₂, clano, S(=O)_nA¹ o C(=O)A²,

R significa alquilo C₁-C₈ o alquilcarbonilo C₁-C₈,

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

n es 0, 1 ó 2,

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

m es 0 ó 1, 2, 3, 4 ó 5,

R¹ significa alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, halógenocicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₈, alcadlenilo C₄-C₁₀, halógenoalquenilo C₂-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, alquinilo C₂-C₈, halógenoalquinilo C₂-C₈ o cicloalquinilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R² significa hidrógeno o uno e los grupos mencionados para R¹,

R¹ y R² también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un átomo del grupo O, N y S y/o llevar uno o varios sustituyentes del grupo halógeno, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈ y oxi -alquilenoxi-C₁-C₈ o en donde un átomo de N y un átomo de C vecino pueden estar ligados por medio de una cadena de alquileo de C₁-C₄,

donde R¹ y/o R² pueden estar sustituidos por uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes

R^a significa halógeno, ciano, nitro, hidroxil, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, alquilcarbonilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈, halógenoalcoxi C₁-C₈, alcoxi-C₁-C₈-carbonilo, alquilo C₁-C₈, alquilamino C₁-C₈, di -alquil-C₁-C₈amino, alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alquiniloxi C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, un heterociclo de cinco a diez miembros, saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R^b significa halógeno, ciano, nitró, hidróxido, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquénilo, alquéniloxi, alquíniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquilito, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, cuyos grupos alquilo en estos radicales contienen 1 a 6 átomos de carbono y cuyos grupos alquénilo o alquínilo mencionados en estos radicales contienen 2 a 8 átomos de carbono.

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterocíclico, heterociclilo, cuyos sistemas cíclicos contienen 3 a 10 miembros anulares, anilo, anloxi, ariltio, ani-alcoxi-C₁-C₆, ani -alquilo-C₁-C₆, hetanilo, hetanloxi, hetanltio, conteniendo los radicales anilo, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetanilo 5 ó 6 miembros anulares, cuyos sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo

X significa halógeno, clano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₂,

Y significa un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S, o uno de los grupos mencionados para X, cuyos grupos pueden estar sustituidos por uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes, nitro, amino, -CHO, -NHCO-NH -alquilo-C₁-C₆, -NHCO-O -alquilo-C₁-C₆, -CO-NH₂,

p es 1 ó 2, pudiendo los grupos Y ser diferentes cuando p = 2,

p es 0 cuando el grupo X es ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₄

Además, la invención se refiere a procedimientos y productos intermedios para la obtención de estos compuestos, a productos que los contienen, así como a su uso para combatir hongos fitopatógenos

De las memorias US 4 567 263, WO 96/35690, US 5 817 663 se conocen, generalmente, pirazolopirimidinas. En la WO 02/48151 se divulgan 6-fenil-pirazolopirimidinas, en las que el grupo fenilo está sustituido por uno a cuatro grupos. En la EP-A 71 792 se describen 7-amino-pirazolopirimidinas, que pueden estar sustituidas en la posición 2 y/o 3. De la JP 2002-308878A y la JP 2002-308879A se conocen pirazolopirimidinas sustituidas en la posición 2. Los compuestos descritos en las memorias mencionadas se conocen como productos para controlar hongos nocivos.

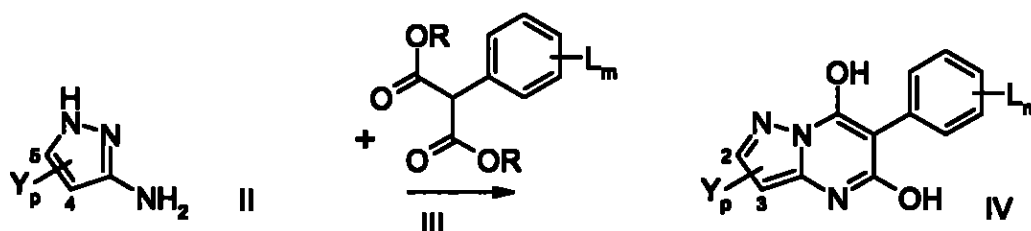
Sin embargo, el efecto de los compuestos conocidos no es satisfactorio en muchos casos. Partiendo de ello, la presente invención tiene por objeto proveer compuestos con efecto mejorado y/o un espectro de acción más amplio.

Por tanto, se encontraron los compuestos definidos al comienzo. Además, se encontraron procedimientos y productos intermedios para su obtención, productos que los contienen, así como un procedimiento para combatir hongos nocivos usando los compuestos I.

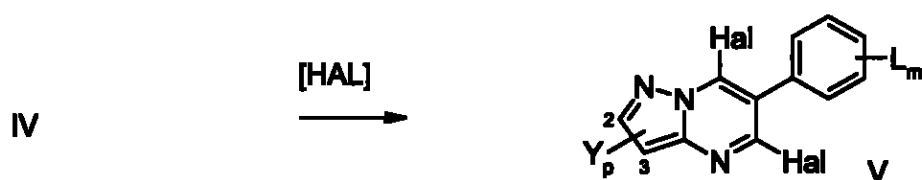
Los compuestos de la invención se diferencian de los compuestos mencionados en la EP-A 71 792 por la sustitución del grupo 7-amino, de los compuestos descritos en la WO 02/48151 por la sustitución en la posición 2 y/o 3 del esqueleto de pirazolopirimidina y de los compuestos conocidos de la JP 2002-308878A y JP 2002-308879A por la sustitución en la posición 5.

Los compuestos de la fórmula I presentan una eficiencia más alta contra hongos nocivos que los compuestos conocidos.

Los compuestos de la invención pueden ser preparados mediante diferentes métodos. Generalmente, se preparan partiendo de derivados sustituidos de aminopirazol II y 2-fenilmalonatos III bajo las condiciones conocidas de la memoria WO 02/48151. En la fórmula III, R representa un grupo alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente, metilo o etilo. Los pirazoles II se obtienen, en parte, en el comercio o pueden ser preparados bajo condiciones en sí conocidas. Los compuestos de partida III se preparan, ventajosamente, bajo las condiciones mencionadas en la EP-A 10 02 788.



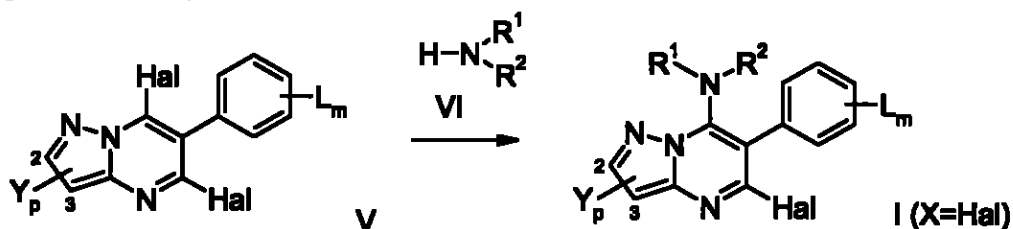
Las 5,7-dihidroxi-6-fenilpirazolopirimidinas IV se transforman con agentes de halogenación [HAL] en 7-halógenopirazolopirimidinas de la fórmula V



En las fórmula IV y V, las variables tienen las definiciones indicadas para la fórmula I y "Hal" significa un átomo de halógeno, preferentemente, bromo o cloro

Preferentemente, se usan agentes de cloración o agentes de bromación, tales como oxibromuro fosfórico, oxidloruro fosfónico, cloruro de tionilo, bromuro de tionilo o cloruro de sulfonio. La reacción puede ser efectuada en ausencia de disolvente o en presencia de un disolvente. Las temperaturas de reacción usuales varían de 0 a 150°C o, preferentemente, de 80 a 125°C

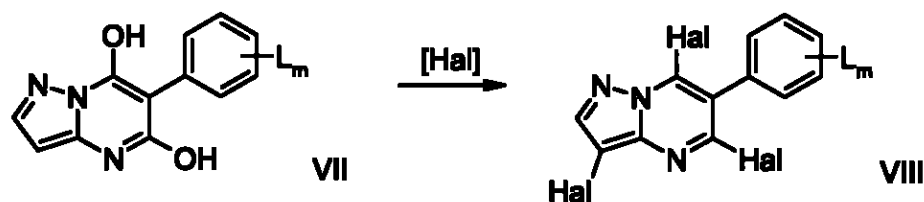
A partir de los compuestos de la fórmula V se obtienen por reacción con aminas de la fórmula VI, pirazolopirimidinas de la fórmula I, en los que X significa halógeno. Estas son un objeto preferido de la presente invención, Son especialmente preferidas las pirazolopirimidinas, que llevan un grupo Y en la posición 3



La reacción de V con aminas VI se efectúa, ventajosamente, a 0°C a 70°C, preferentemente, a 10°C a 35°C, de preferencia en presencia de un disolvente inerte, tal como un éter, p ej. dioxano, éter dietílico o especialmente, tetrahydrofurano, hidrocarburos halogenados, p ej. diclorometano y hidrocarburos aromáticos, como, por ejemplo, tolueno [ver WO 98/46608, WO 02/48151]

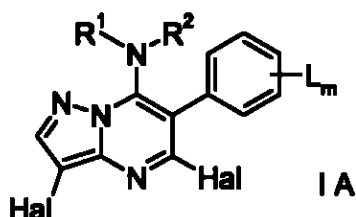
Preferentemente, se usa una base, por ejemplo una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o una base inorgánica, p ej carbonato de potasio, como base se puede usar igualmente un exceso de la amina de la fórmula IV

Ventajosamente, se obtienen los compuestos de la fórmula I, que llevan un grupo Y en la posición 3, partiendo de 5,7-dihidroxipirazolopirimidinas VII por reacción con un agente de halogenación. Las trihalógenopirazolopirimidinas de la fórmula VIII así obtenidas son valiosos productos secundarios para la obtención de los compuestos de la fórmula I.



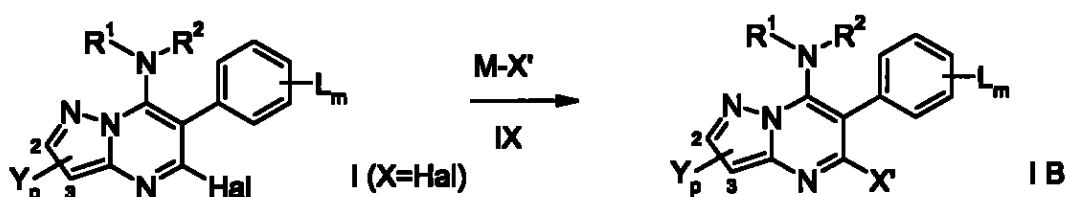
La definición de las variables en las fórmulas VII y VIII equivale a aquella para las variables de la fórmula I y "Hal" representa un átomo de halógeno, preferentemente, bromo o cloro. La halogenación se efectúa en analogía a la de los compuestos IV.

A partir de los compuestos VIII se pueden preparar por condensación con aminas VI, bajo las condiciones arriba descritas, los compuestos I A. Representan un objeto especialmente preferido de la presente invención. Los compuestos I A también son valiosos productos intermedios para la preparación de otros compuestos I.



Las 5,7-dihidroxipirazolopirimidinas de la fórmula II se conocen de la WO 02/48151 Las aminas la fórmula VI son en parte conocidas, se obtienen en el comercio o pueden ser preparadas mediante métodos conocidos

Los compuestos I, en los que X en la posición 5 represente ciano, alcoxi C₁-C₃ o halógenoalcoxi C₁-C₂ (fórmula I B), se pueden preparar, ventajosamente, partiendo de las sustancias de partida de la fórmula I A mediante los métodos esbozados a continuación

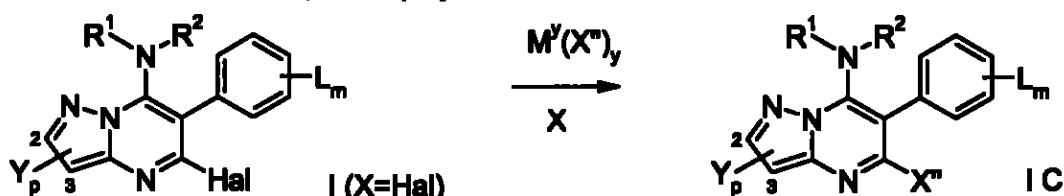


Los compuestos I (X=Hal) se transforman con compuestos M-X' (fórmula IX) en compuestos I B. Dependiendo del significado del grupo X' a incorporar, los compuestos IX representan un cianuro inorgánico o un alcoxilato. La reacción se efectúa, ventajosamente, en presencia de un disolvente inerte. El catión M en la fórmula IX tiene poca importancia, pero por razones prácticas se suelen usar sales de amonio, tetraalquilamonio o sales de metal alcalino o alcalinotérreo.

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

Los compuestos I, en los que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄ (fórmula I C), se pueden preparar, ventajosamente, partiendo de compuestos de la fórmula I, en los que X significa halógeno, mediante los métodos esbozados a continuación

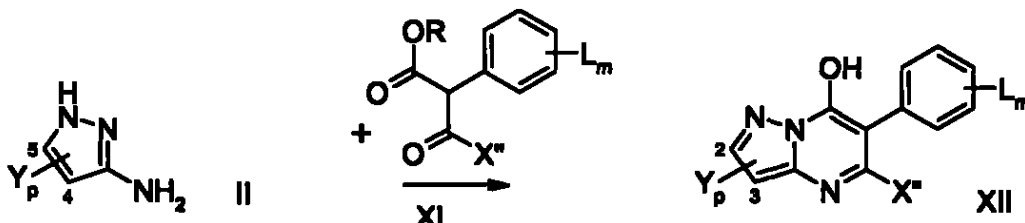
Los compuestos de la fórmula I C, en los que Xⁿ significa alquilo C₁-C₄, se pueden preparar por acoplamiento de 5-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula IV A con reactivos de metal orgánicos de la fórmula X En una variante de este procedimiento se realiza la reacción bajo catálisis de un metal transitorio, como p.ej. catálisis de Ni o de Pd



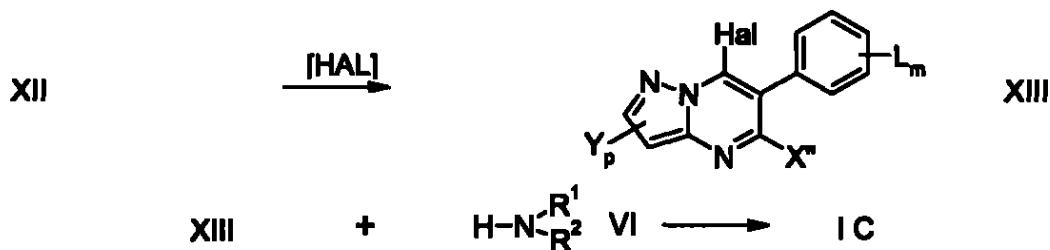
En la fórmula X, Xⁿ representa alquilo C₁-C₄ y M representa un ión de metal de la valencia Y, como por ejemplo, B, Zn o Sn. Esta reacción puede realizarse en analogía a los siguientes métodos: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), loc. cit. 1, 2345 (1996), WO 99/41255, Aust. J. Chem., Vol. 43,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

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

Partiendo de derivados de aminotriazol II y ceto ésteres XI se obtienen las 5-alkil-7-hidroxi-6-fenilpirazolopirimidinas XII. En la fórmula XI, R representa un grupo alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente, metilo o etilo. Usando los ésteres fenilacéticos fáciles de preparar Xia, donde $X''=CH_3$, se obtienen las 5-metil-7-hidroxi-6-fenilpirazolopirimidinas [ver Chem Pharm Bull, 9, 801, (1961)]. El 5-amino-1,2,4-triazol VI se obtiene en el comercio. Los compuestos de partida XI se preparan, ventajosamente, bajo las condiciones indicadas en la memoria EP-A 10 02 788.

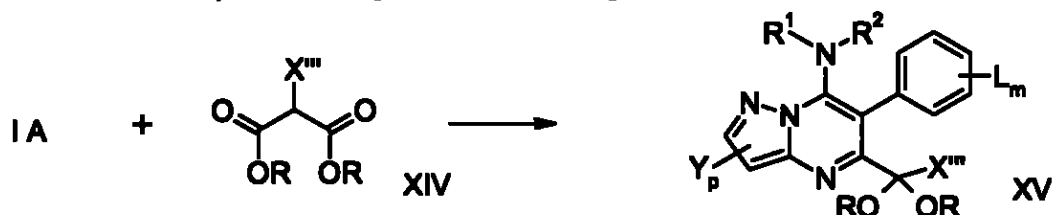


Las 5-alkil-7-hidroxi-6-fenilpirazolopirimidinas XII así obtenidas se transforman análogamente a los compuestos IV con agentes de halogenación [HAL] en 7-halógenopirazolopirimidinas de la fórmula XIII.



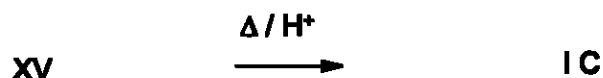
La transformación de XIII con aminas VI se realiza en analogía a la reacción de los compuestos V con VI.

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



Los malonatos XIV se conocen de la literatura [J Am Chem Soc, Vol 64, 2714 (1942), J Org Chem, Vol 39, 2172 (1974), Helv Chim Acta, Vol 61, 1585 (1978)] o pueden ser preparados según la literatura

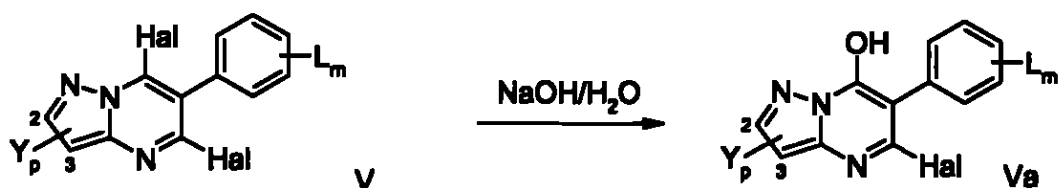
La subsiguiente saponificación del éster XV se realiza bajo las condiciones usuales, dependiendo de los diferentes elementos estructurales, puede ser ventajoso efectuar una saponificación alcalina o ácida de los compuestos XV. Bajo las condiciones de la saponificación de éster, se puede realizar la descarboxilación en I C ya total o parcialmente



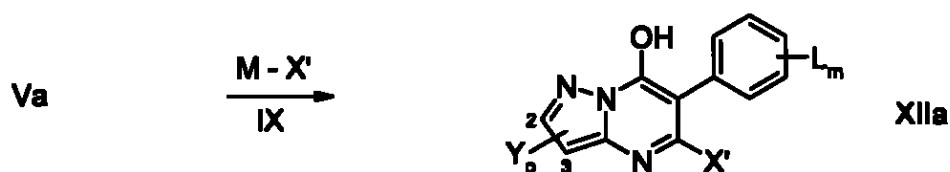
La descarboxilación se realiza, generalmente, a temperaturas de 20°C a 180°C, preferentemente, 50°C a 120°C, en un disolvente inerte, en caso dado, en presencia de un ácido

Los compuestos de fórmula I en donde cada x es un grupo CN o alcoxi C₁-C₄ (fórmula I D) pueden obtenerse por la siguiente ruta de síntesis

Por hidrólisis selectiva, las 5,7 – dihalopirazolopirimidinas de la formula V son convertidas en 5– halo-7-hidroxipirazolopirimidinas de la formula Va, análogamente a Chem Pharm Bull 1961, 9801 (triazolopirimidinas) o J Agric Food Chem 41, 12, 1993, 2411 (pirimidinas), o por medio de catálisis ácida usando HCL al 10% en dioxano de acuerdo con khim Geterotsiki Soedin Ru, 21, 3, 1986, 378 (pirimidinas)

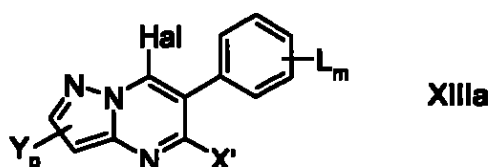


Usando agentes organometálicos de la formula IX, las 5–halo-7-hidroxipirazolopirimidinas obtenidas de ésta manera se convierten en compuestos de la formula Xlla

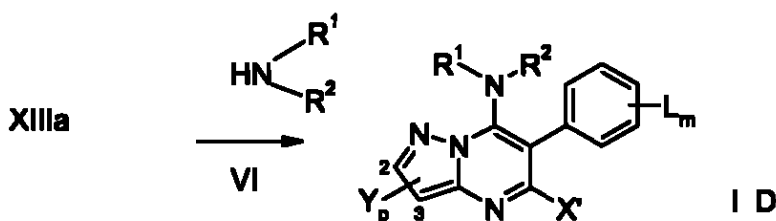


En donde X' es CN o alcoxi-C₁-C₄,

Seguida por una halogenación de Xlla para dar compuestos de la formula Xllla



Y la reaccion de Xllla con aminas de la formula VI para dar compuestos de la fórmula I D análogamente a la preparación de los compuestos I A



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

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

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

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

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

halógeno: fluoro, cloro, bromo y yodo,

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

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 2, 4 ó 6 átomos de carbono (como los arriba mencionados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o

completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los arriba mencionados especialmente, halógenoalquilo C_1-C_2 , tales como 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-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-trcloroetilo, pentafluoroetilo ó 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo,

alquenilo radicales hidrocarburo ramificados o lineales no saturados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en una posición arbitraria, p ej alquenilo C_2-C_8 , tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletanilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo,

halógenoalquenilo radicales hidrocarburo insaturados lineales o ramificados con 2 a 10 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces 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, fluoro, cloro y bromo,

alquinilo grupos de hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en posición arbitraria, como p ej alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, p ej etnilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo,

cicloalquilo grupos de hidrocarburo saturados mono o bicíclicos con 3 a 6 o 8 miembros anulares de carbono, como p ej cicloalquilo C_3-C_8 , p ej ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo,

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

- heterociclilo saturado de 5 ó 6 miembros, que contiene uno a tres átomos de oxígeno 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, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-piperidinilo, 3-pipendinilo, 4-pipendinilo, 1,3-dioxano-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropindacnilo, 4-hexahidropindacnilo, 2-hexahidropinmidinilo, 4-hexahidropinmidinilo, 5-hexahidropinmidinilo y 2-piperacnilo,
- heterociclilo parcialmente insaturado con 5 ó 6 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 3,6-dihidro-2H-piridin-1-ilo y 2,5-dihidro-pirrol-1-ilo
- heteroanilo 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 heteroanilo pentacíclicos, que pueden contener además de átomos de carbono, uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros anulares, p ej 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, y 1,3,4-triazol-2-ilo,

- heteroarilo de seis miembros, que contiene uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno

grupos heteroarilo hexacíclicos, que pueden contener además de átomos de carbono, uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros anulares, p ej 2-píndinilo, 3-pírdinilo, 4-píndinilo, 3-píndacnilo, 4-píndacnilo, 2-pírmidinilo, 4-pírmidinilo, 5-pírmidinilo y 2-píracnilo,

alquileo cadena divalentes no ramificadas de 3 a 5 grupos CH_2 , p ej CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ y $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$,

oxalquileo cadenas divalentes ramificadas de 2 a 4 grupos CH_2 , donde una valencia está unida por vía de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p ej OCH_2CH_2 , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$,

oxalquilenoxi cadenas divalentes ramificadas de 1 a 3 grupos CH_2 , donde ambas valencias están ligadas por vía de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p ej OCH_2O , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$,

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

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

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

Son preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆ o halógenoalquilo C₁-C₆

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa un grupo alquenilo o alquinilo, que en el átomo de α-C presenta una ramificación. En estos casos, el grupo R¹ es un grupo A



donde # representa el enlace con el átomo de nitrógeno y

R¹¹ significa alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃,

R¹² significa hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o halógenoalquilo C₁-C₃,

R¹³ significa alquenilo C₂-C₁₀ o alquinilo C₂-C₆, donde R¹³ puede ser no sustituido o estar parcial o completamente halogenado y/o llevar uno a tres grupos R^a

También son preferidos los compuestos I, en los que R¹ representa un heterociclo saturado o aromático con 5 ó 6 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos del grupo N, O y S, que puede estar sustituido por uno o dos grupos alquilo o halógenoalquilo

Son preferidos los compuestos I, en los que R¹ representa un grupo B



donde

Z^1 significa hidrógeno, fluoro o fluoroalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$,

Z^2 significa hidrógeno o fluoro, o

Z^1 y Z^2 forman juntos un doble enlace,

q es 0 ó 1, y

R^3 significa hidrógeno o metilo

Además, son preferidos los compuestos I, en los que R^1 significa cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, que puede estar sustituido por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^2 significa hidrógeno

También son preferidos los compuestos I en los que R^2 significa metilo o etilo

Si R^1 y/o R^2 significan grupos halógenoalquilo o halógenoalquenilo con centros de quiralidad, se prefieren para estos grupos los isómeros (S). En caso de grupos alquilo o alquenilo exentos de halógeno con centros de quiralidad en R^1 o R^2 , se prefieren los isómeros de la configuración (R)

Además, 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 saturado o insaturado de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un átomo del grupo O, N y S y/o llevar uno o varios sustituyentes del grupo halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, halógenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ y oxi -alquilenoxi- $\text{C}_1\text{-C}_3$ o donde dos

miembros anulares vecinos pueden estar ligados por medio de una cadena de alquileo con 1 a 4 átomos de carbono

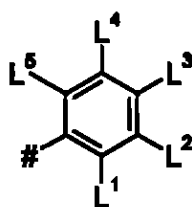
Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^1 y R^2 forman junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados, un anillo piperidinilo, morfolinilo o tiomorfolinilo, especialmente, un anillo piperidinilo, que en caso dado está sustituido por uno a tres grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógenoalquilo C_1-C_4 , especialmente, por 4-metilo

Otro objeto prefendo de la presente invención son compuestos I, en los que R^1 y R^2 forman junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados, un anillo pirazol, que en caso dado está sustituido por uno o dos grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o halógenoalquilo C_1-C_4 , especialmente, por 3,5-dimetilo ó 3,5-di-(trifluorometilo)

Son preferidos los compuestos I, en los que por lo menos un grupo L se encuentra en posición orto con respecto al lugar de enlace con el esqueleto de pirazolopirimidina, especialmente, aquellos, en los que n tiene el valor 1, 2 ó 3

Son preferidos los compuestos I, en los que L_m significa halógeno, metilo, etilo, C_1 -halógenoalquilo, metoxi o $-C(=O)-A^2$, donde A^2 es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , halógenoalcoxi C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_2 o di -alquilamino- C_1-C_2

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



C

donde # representa el lugar de enlace con es esqueleto de pirazolopirimidina y

L¹ es fluoro, cloro, CH₃ o CF₃,

L², L⁴ significan, independientemente, hidrógeno o fluoro,

L³ es hidrógeno, fluoro, cloro, ciano, CH₃, OCH₃ o COOCH₃, y

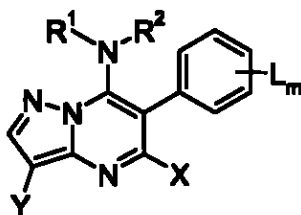
L⁵ es hidrógeno, fluoro o CH₃

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que X significa halógeno o alquilo C₁-C₄, como p ej cloro o metilo, especialmente, cloro

Adicionalmente, son preferidos los compuestos I, en los que Y significa halógeno, especialmente, fluoro o cloro, o alquilo, especialmente, metilo En una modalidad especialmente preferida de la invención, el grupo X es un átomo de cloro e Y significa fluoro, cloro o metilo

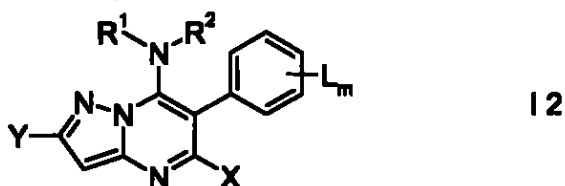
Además, son prferidos los compuestos I, en los que el índice p = 1

También son preferidos los compuestos I, en los que el grupo Y se encuentra en la posición 3 del esqueleto de pirimidina (fórmula I 1)

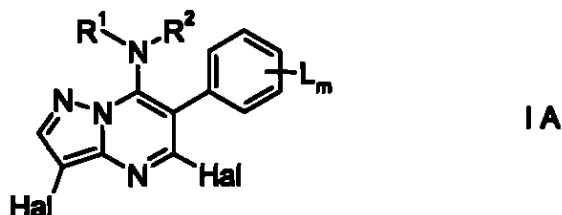


I 1

En otra modalidad prefenda de la invención, el grupo Y se encuentra en la posición 2 del esqueleto de pirimidina (fórmula I 2)



Los compuestos de la fórmula I A son un objeto prefendo de la invención



Sobre todo con respecto a su uso son especialmente preferidos los compuestos I alistados en las Tabla siguientes. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente son, independientemente de la combinación en la que se mencionan, una variante especialmente preferida del respectivo sustituyente.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-fluoro-6-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-dicloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-fluoro-6-metilo y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,4,6-trifluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metoxi y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa pentafluoro y la

combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m 2-metil-4-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m 2-trifluormetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m 2-metoxi-6-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-cloro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 12

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 13

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,4-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-fluoro-4-chlor y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,3-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,5-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,3,4-trifluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-metilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 20

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,4-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 21

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-metil-4-cloro y la

combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 22

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-fluoro-4-metilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,4,6-trimetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-ciano y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 26

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metilo y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 27

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metoxycarbonil y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-trifluorometil-4-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 29

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I 1, en los que X e Y significan cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 31

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-fluoro-6-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 32

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,6-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 33

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,6-dicloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 34

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-fluoro-6-metilo y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 35

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,4,6-

trifluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 36

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

Tabla 37

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa pentafluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-metil-4-fluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 39

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-trifluorometilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 40

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-metoxi-6-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 41

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 42

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 43

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m 2,4-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 44

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-fluoro-4-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 45

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 46

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,3-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 47

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,5-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 48

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,3,4-trifluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 49

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-metilo

y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 50

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

Tabla 51

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-metil-4-cloro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 52

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

Tabla 53

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,6-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 54

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,4,6-trimetilo y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 55

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,6-difluoro-4-ciano y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 56

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2,6-difluoro-4-metilo y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 57

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

Tabla 58

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-trifluorometil-4-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 59

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-trifluorometil-5-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 60

Compuestos de la fórmula I 2, en los que X significa cloro, Y significa metilo, L_m significa 2-trifluorometil-5-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 61

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X mety, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-fluoro-6-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 62

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,6-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 63

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa

2,6-dicloro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 64

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-fluoro-6-metilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 65

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,4,6-trifluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 66

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

Tabla 67

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa pentafluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 68

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-metil-4-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 69

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-trifluorometilo y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 70

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-metoxi-6-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 71

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 72

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 73

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,4-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 74

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-fluoro-4-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 75

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 76

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,3-difluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 77

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa

2,5-difluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 78

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,3,4-trifluoro y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 79

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-metilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 80

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,4-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 81

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

Tabla 82

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

Tabla 83

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,6-dimetilo y la combinación de R^1 y R^2 corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 84

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

Tabla 85

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

Tabla 86

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

105

Tabla 87

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2,6-difluoro-4-metoxycarbonil y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 88

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-trifluorometil-4-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 89

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-trifluorometil-5-fluoro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea respectivamente, de la Tabla A

Tabla 90

Compuestos de la fórmula I 3, en los que X significa metilo, Y significa hidrógeno, L_m significa 2-trifluorometil-5-cloro y la combinación de R¹ y R² corresponde a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla A

No	R ¹	R ²
A-1	CH ₃	H
A-2	CH ₃	CH ₃

No	R ¹	R ²
A-3	CH ₂ CH ₃	H
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₂ CF ₃	H
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-8	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-9	CH ₂ CCl ₃	H
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-11	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-16	CH(CH ₃) ₂	H
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-18	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-20	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-21	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-22	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-24	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-28	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-29	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-30	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-33	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃

No	R ¹	R ²
A-35	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-42	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-48	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-66	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H

108

No	R ¹	R ²
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-72	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-77	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-78	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-79	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-80	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-81	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-82	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-83	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-84	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-85	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-86	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-87	CH ₂ -C≡CH	H
A-88	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-89	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-90	ciclopentilo	H
A-91	ciclopentilo	CH ₃
A-92	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃
A-93	ciclohexilo	H
A-94	ciclohexilo	CH ₃
A-95	ciclohexilo	CH ₂ CH ₃
A-96	CH ₂ -C ₆ H ₅	H
A-97	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃
A-98	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃

No	R ¹	R ²
A-99	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-100	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-101	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-102	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-103	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-104	-CH ₂ CHF(CH ₂) ₃ -	
A-105	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-106	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-107	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-108	-(CH ₂) ₆ -	
A-109	-(CH ₂) ₄ -	
A-110	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-111	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-112	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-113	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-114	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-115	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	
A-116	-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-117	-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-118	-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -	
A-119	-(CH ₂)-CH=CH-(CH ₂) ₂ -	
A-120	-(CH ₂) ₈ -	
A-121	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₆ -	
A-122	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-123	-N=CH-CH=CH-	
A-124	-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-	
A-125	-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-	

Los compuestos I son apropiados como fungicidas. Se destacan por ser excelentemente efectivos contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, especialmente, de la clase de los



ascomicetos, deuteromicetos, oomicetos y basidiomicetos En parte son sistémicamente activos y pueden ser usados en la protección de plantas como fungicidas foliares y del suelo

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

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,
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
- especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Plasmopara viticola* en vid,
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales,
- *Pyricularia oryzae* en arroz,
- especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,

- *Uncinula necator* en vid,
- especies de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, así como
- especies de *Venturia*-Arten (roña) en manzanas y peras

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

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

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

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

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

En la protección de materiales o de productos almacenados, la cantidad de aplicación de ingrediente activo depende de la naturaleza de la aplicación y del efecto deseado. Las cantidades de aplicación generalmente usados para la protección de materiales varían, por

ejemplo, de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, de 0,005 g a 1 kg, de ingrediente activo por metro cúbico del material tratado

Los compuestos I pueden ser transformados en las formulaciones acostumbradas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. 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

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, ácidos grasos y ésteres grasos.

Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,

sustancias soporte, tales como polvos de piedras naturales (p ej caolinas, 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 anilo) y dispersantes, tales como lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.

Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polioxetileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, tristearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de 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

114

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

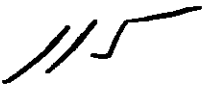
Generalmente, las formulaciones contienen entre 0,01 y 95% en peso, preferentemente, entre 0,1 y 90% en peso del principio activo Los principios activos se usan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, de 95% a 100% (según espectro de NMR)

Ejemplos de formulaciones son 1 Productos para la dilución con agua

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 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 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% 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 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.

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 obtiene una suspensión estable del ingrediente activo.

116

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

50 partes en peso de los principios activos son molidos finamente, adicionando 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

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

2 Productos para la aplicación directa**H) Polvos pulverizables (DP)**

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)

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



118

J) Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

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

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

Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (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 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%.

119

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 aún el ingrediente activo sin aditivos

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

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

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

- acilalaninas, tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo,
- derivados de amina, tales como Aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf,
- anilino-pirimidinas, tales como pirmetanilo, mepanipirim o clodínilo,

- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomina,
- azoles, tales como biteranol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miconobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protoconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol,
- dicarboximidas, tales como Iprodiona, miconozolina, procimidona, vinclozolina,
- ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb polycarbamato, tiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilazina, benomilo, boscalid, carbendazim, carboxina, oxycarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamldona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotilano, mepronilo, nuanmol, probenazol, proquinacida, pirfenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, tricloazol, trifonina,
- fungicidas de cobre, tales como caldo de Bordeaux, acetato de cobre, ocloruro de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacilo, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles, tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,
- azufre,
- otros fungicidas, tales como acibencenoar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamid, cimoxanilo, dazomet, diclomezcna, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, fenmzona, fluaznam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintoceno, zoxamida,

121

- estrobiluninas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico, tales como captan, diclofluanida, folpet, tolilfluanida,
- amidas de ácido cláamico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf

Ejemplos de síntesis

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

Ejemplo 1 2-metil-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-5,7-diol [I-1]

Una mezcla de 3 g (10,3 mmol) de 2-(2,4,6-trifluorofenil)malonato de dietilo, 1 g (10,3 mmol) de 3-amino-5-metilpirazol y 2,11 g (11,4 mmol) de tributilamina se calentó durante 5 horas a 140°C, destilándose el etanol formado. Después del enfriamiento a 20-25°C se mezcló con solución de NaOH al aprox. 10%. La mezcla se extrajo con éter metil-terc-butílico y la fase acuosa se acidificó con solución diluida de HCl. Los cristales precipitados se filtraron y se secaron. Se obtuvieron 3 g del compuesto indicado en el título del p.f. 304°C.

Ejemplo 2 3,5,7-tricloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5-a]pirimidina [II-1]

3,0 g (10,7 mmol) de 6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-5,7-diol (ver WO 02/48151), 2,22 g (10,7 mmol) de pentacloruro fosfónico, 9,72 g (42,6 mmol) de cloruro de

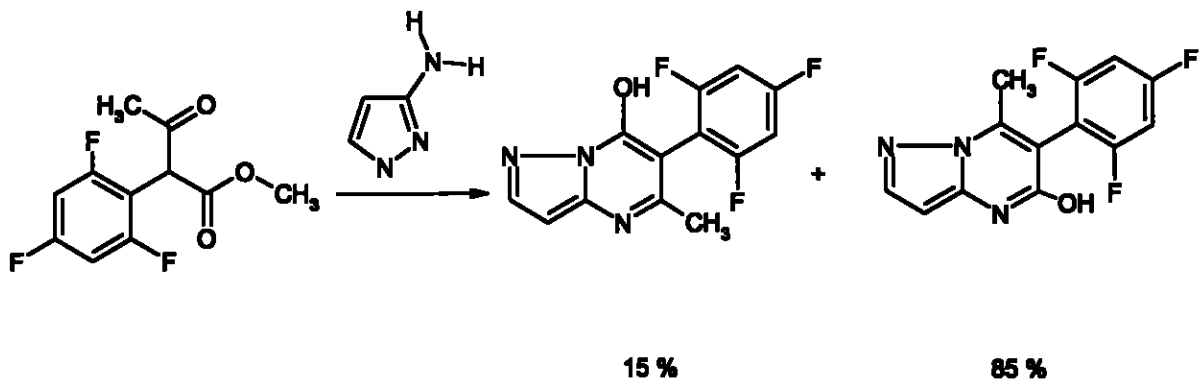
benciltrietilamonio se calentaron durante 20 horas a reflujo en una solución de 40 ml de cloruro de fosfonio y 35 ml de acetonitrilo. Después del enfriamiento se libró la mezcla de reacción de los componentes volátiles y se absorbió el residuo en diclorometano. La solución se vertió sobre agua helada y se neutralizó con solución de carbonato de sodio. Después de la separación de las fases se lavó la fase orgánica con agua, se secó y se libró del disolvente. A partir del residuo se obtuvieron tras cromatografía en silicagel (mezclas de ciclohexano-éster acético) 0,5 g del compuesto indicado en el título del p f 128°C

Ejemplo 3 3,5-dicloro-7-(4-metil-pipendin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5-a]pirimidina [III-1]

Una solución de 0,1 g (0,284 mmol) de 3,5,7-tricloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5-a]pirimidina (Ej 2), 0,03 g (0,284 mmol) de 4-metilpipendina y 0,03 g de trietilamina en 1 ml de diclorometano se agitó aprox 4 horas a 20-25°C. Después adicionar agua y de separar las fases se lavó la fase orgánica con solución diluida de HCl y agua, se secó y se eliminó el disolvente. A partir del residuo se obtuvieron 0,102 mg del compuesto indicado en el título del f p 138°C erhalten

Ejemplo 4 5-metil-7-(4-metilpipendin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo [1,5a]pirimidina

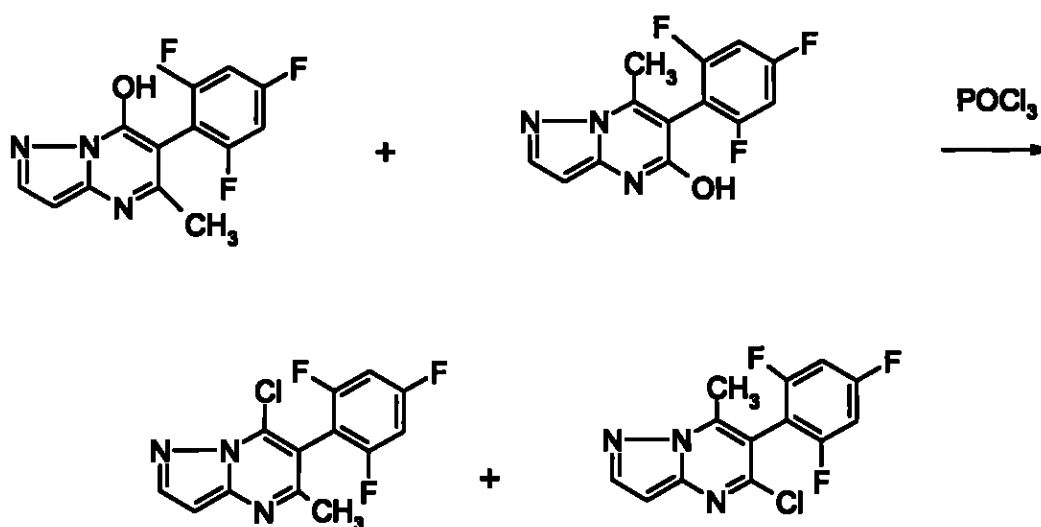
Etapas a 5-metil-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5a]pirimidin-7-ol



Una mezcla de 2 g (0 0081 mol) de 3-oxo-2-(2,4,6-trifluorofenil)butanoato de metilo, 0 68 g (0 0081 mol) de 3-aminopirazol y 1 66 g (0 0089mol) de tributilamina se agitó durante 4 horas a 160°C, destilándose el metanol formado Después del enfriamiento se mezcló con solución de hidróxido sódico al 10 % La mezcla se extrajo con éter metil-terc butílico y la fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico diluido Los cristales así formados se filtraron y se secaron Se obtuvieron 1,9 g de una mezcla isómera, que constaba en 15 % del compuesto indicado en el título y en un 85 % de 7-metil-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5a] pirimidin-5-ol La mezcla isómera se transformó ulteriormente sin purificación previa

124

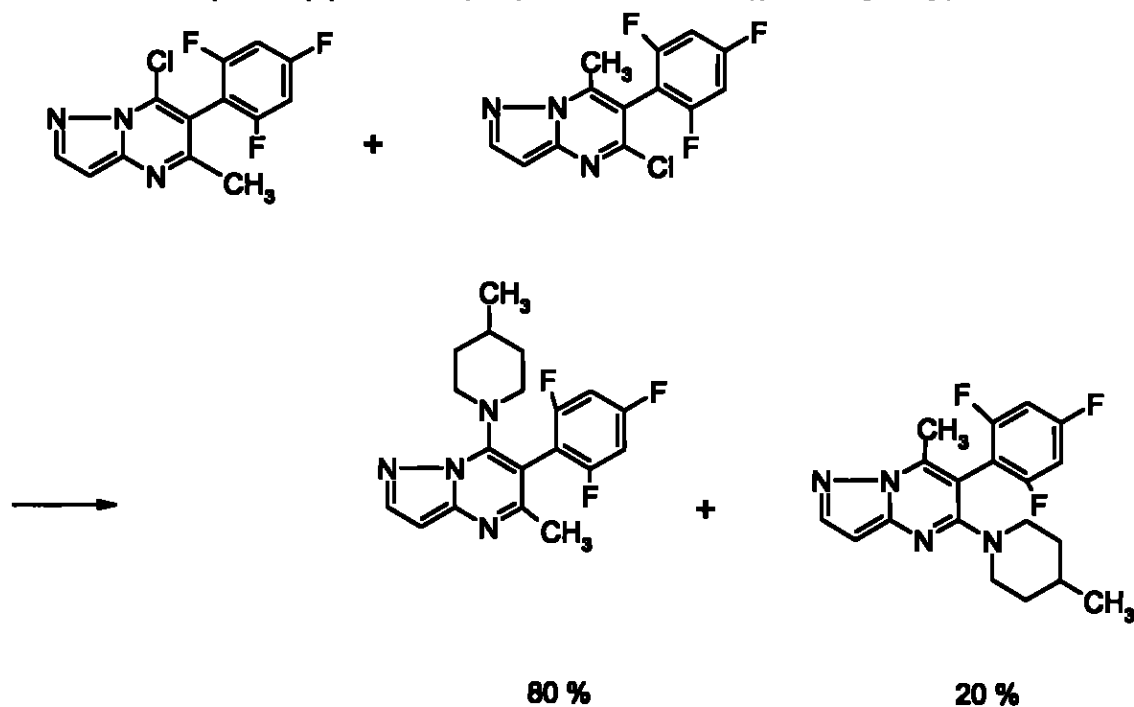
Etapas b 7-cloro-5-metil-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5a]pinimidina



2,8 g (0 01mol) de la mezcla isómera arriba obtenida se calentaron durante 6 horas a reflujo en 10 ml oxloruro fosfónico Después del enfriamiento se vertió la mezcla de reacción cuidadosamente sobre agua helada, se reguló con solución de carbonato sódico a pH 7-8, se extrajo dos veces con éster acético y se secaron las fases orgánicas reunidas Después de concentrar se obtuvieron 2,6 g de la mezcla isómera, que contenía el compuesto indicado en el título en una proporción de un 15%

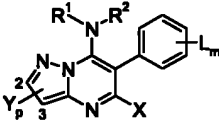
Tras cromatografía en silicagel (mezcla de ciclohexano éster acético) se obtuvieron 400mg de una mezcla isómera, que contenía aprox un 80% del compuesto indicado en el título

Etapas c 5-metil-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)pirazolo[1,5a] pirimidina



0,4 g de la mezcla isómera arriba obtenida (0,0013mol) y 0,25g (0,0025mol) de 4-metilpiperidina se agitaron durante 4 horas a 40°C y durante 12 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción fue absorbida en éster acético, lavada dos veces con ácido clorhídrico al 5% y luego con agua, secada y concentrada. El residuo fue purificado por cromatografía, obteniéndose 0,176 g de una mezcla isómera, que contenía el compuesto indicado en el título en una proporción del 80%.

Tabla III – Compuestos de la fórmula I



I

No	Y _p	R ¹		R ²	X	L _m	Datos físicos (p f [°C])
III-1	3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	138
III-2	2-CH ₃ -3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	135
III-3	2-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	185
III-4	2-CH ₃	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	183
III-5	2-CH ₃ -3-Cl	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	152
III-6	3-Cl	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	89 (decomp)
III-7	2,3-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	oil
III-8	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -			Cl	2,4,6-F ₃	8 08 *
III-9 Isomer A	3-CN	(CH ₃) ₂ CHCH(CH ₃)-		H	Cl	2,4,6-F ₃	8 23 *
III-10 Isomer B	3-CN	(CH ₃) ₂ CHCH(CH ₃)-		H	Cl	2,4,6-F ₃	8 24 *
III-11 Isomer A	3-CN	(CH ₃) ₃ CH(CH ₃)-		H	Cl	2,4,6-F ₃	8 24 *
III-12 Isomer B	3-CN	(CH ₃) ₃ CH(CH ₃)-		H	Cl	2,4,6-F ₃	8 23 *

No	Y _p	R ¹	R ²	X	L _m	phys. Daten (Fp [°C])
III-13	3-CN	CH ₃ CH ₂ -	CH ₃ CH ₂ -	Cl	2,4,6-F ₃	8 31 *
III-14	3-CN	CH ₂ C(CH ₃)CH ₂ -	CH ₃ CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	8 35 *
III-15	3-CN	(CH ₃) ₂ CH-	H	Cl	2,4,6-F ₃	146
III-16	3-CN	CH ₃ CH ₂ CH(CH ₃)-	H	Cl	2,4,6-F ₃	119
III-17	3-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	2,4,6-F ₃	153
III-18	3-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OH	2,4,6-F ₃	234
III-19	3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CN	2,4,6-F ₃	7 9 *
III-20	3-Cl	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	2,4,6-F ₃	8 13 *
III-21	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	2,4,6-F ₃	8 62 *
III-22	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CN	2,4,6-F ₃	150
III-23	3-CN	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₃	2,4,6-F ₃	8 27 *

* ¹H-NMR(CDCl₃) 1H(H-2)

Ejemplos de la acción contra hongos nocivos

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

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

Ejemplo de aplicación 1 - Eficiencia contra el moho gris en hojas de pimiento causado por *Botrytis cinerea*

Plántulas de pimiento de la variedad "Neusiedler Ideal Elite" fueron pulverizadas hasta chorrear, después de que se habían desarrollado bien 4 a 5 hojas, con una suspensión acuosa con la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente, se inocularon las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea*, que contenía $1,7 \times 10^8$ esporas/ml en una solución acuosa al 2% de biomalta. A continuación, se colocaron las plantas de ensayo en una cámara climática con 22 a 24°C y alta humedad del aire. Después de 5 días se podía determinar visualmente la extensión de la infestación por el hongo en %.

En este test, las plantas tratadas con 250 ppm de los ingredientes activos III-1 o bien III-6 de la Tabla III presentaban una infección de, como máximo, un 7%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90%

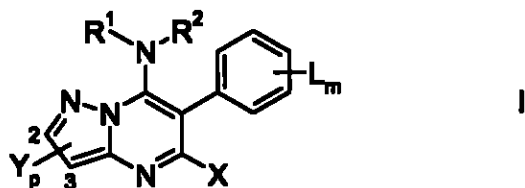
Ejemplo de aplicación 2 – Eficiencia contra el oidio en hojas de pepinos causado *Sphaerotheca fuliginea* en la aplicación protectora

Las hojas de plántulas de pepinos crecidas en macetas de la variedad "Chinesische Schlange" fueron pulverizadas hasta chorrear con suspensiones acuosas de la concentración en principio activo abajo indicada 20 horas después de estar seca la capa pulverizada se inocularon las plantas con suspensiones acuosas de zoosporas del oidio del (*Sphaerotheca fuliginea*) A continuación, se cultivaron las plantas durante 2 días en el invernadero a temperaturas de entre 20 y 24°C y 60 y 80% de humedad relativa del aire Entonces se determinó visualmente la extensión del desarrollo del hongo en % de infección de la superficie de hoja cotiledónea

En este test, las plantas tratadas con 250 ppm de los ingredientes activos III-1 o bien III-6 de la Tabla III no presentaban ninguna infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90%

Reivindicaciones

1 Pirazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes

L significa, independientemente, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , alcoxi, amino C_1-C_6 , NHR, NR_2 , ciano, $S(=O)_nA^1$ o $C(=O)A^2$,

R significa alquilo C_1-C_6 o alquilcarbonilo C_1-C_6 ,

A^1 es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 o di-(alquil- C_1-C_6)amino

n es 0, 1 ó 2,

A^2 es alquenilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , halógenoalcoxi C_1-C_6 o uno de los grupos mencionados para A^1 ,

m es 0 ó 1, 2, 3, 4 ó 5,

R^1 significa alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halógenocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alcadienilo C_4-C_{10} , halógenoalquenilo C_2-C_6 , cicloalquenilo C_3-

C_6 , alquínilo C_2-C_8 , halógenoalquínilo C_2-C_8 o cicloalquínilo C_3-C_8 , fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R^2 significa hidrógeno o uno e los grupos mencionados para R^1 ,

R^1 y R^2 también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un átomo del grupo O, N y S y/o llevar uno o vanos sustituyentes del grupo halógeno, alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 y oxí -alquilenoxi- C_1-C_3 o en donde un átomo de N y un átomo de C vecino pueden estar ligados por medio de una cadena de alquileo de C_1-C_4 ,

donde R^1 y/o R^2 pueden estar sustituidos por uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes

R^a significa halógeno, ciano, nitro, hidroxí, alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , halógenoalcoxi C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -carbonilo, alquítio C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , di -alquil- C_1-C_6 amino, alquénilo C_2-C_6 , alquéniloxi C_2-C_6 , alquíniloxi C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , fenilo, naftilo, un heterociclo de cinco a diez miembros, saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

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

R^b significa halógeno, ciano, nitro, hidroxil, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquinilo, alquinoxil, alcoxi, halógenoalcoxi, alquilito, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, cuyos grupos alquilo en estos radicales contienen 1 a 6 átomos de carbono y cuyos grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales contienen 2 a 8 átomos de carbono,

y/o uno a tres de los radicales siguientes

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterociclilo, cuyos sistemas cíclicos contienen 3 a 10 miembros anulares, anilo, anilo, anilo, anilo, anil-alcoxi- C_1-C_6 , anil -alquilo- C_1-C_6 , hetarilo, hetarilo, hetarilo, hetarilo, conteniendo los radicales anilo, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetarilo 5 ó 6 miembros anulares, cuyos sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo

X significa halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o halógenoalcoxi C_1-C_2 ,

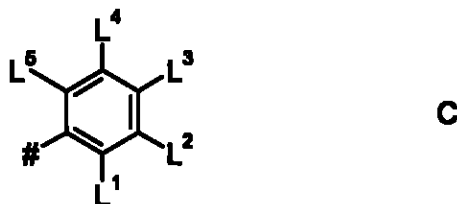
- Y** significa un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S, o uno de los grupos mencionados para X, cuyos grupos pueden estar sustituidos por uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes, nitro, amino, -CHO, -NHCO-NH -alquilo-C₁-C₆, -NHCO-O -alquilo-C₁-C₆, -CO-NH₂.
- p** es 1 ó 2, pudiendo los grupos Y ser diferentes cuando p = 2,
- p** es O cuando el grupo X es ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₄
- 2** Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde X significa halógeno, CN, OH, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄
- 3** Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde X significa halógeno, CN o alquilo C₁-C₄
- 4** Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde X significa halógeno o alquilo C₁-C₄
- 5** Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde X significa halógeno
- 6** Compuestos de la fórmula I según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, donde R¹ y R² tienen los significados siguientes

R^1 es alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , alcoalquilo C_3-C_6 , halógenocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halógenoalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , y

R^2 es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , o

R^1 y R^2 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que pueden llevar uno o dos sustituyentes del grupo halógeno, alquilo C_1-C_6 y halógenoalquilo C_1-C_6 ,

- 7 Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 6, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa el grupo C



donde $\#$ representa el lugar de enlace con el esqueleto de triazolopirimidina y

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

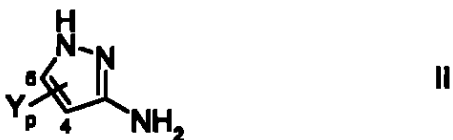
L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno o fluoro,

L^3 significa hidrógeno, fluoro, cloro, ciano, CH_3 , OCH_3 o $COOCH_3$, y

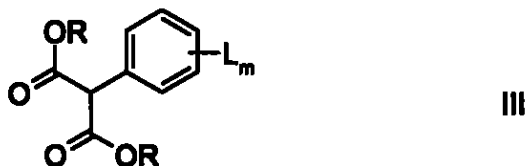
L^5 significa hidrógeno, fluoro o CH_3

- 8 Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en donde X significa halógeno, por reacción de derivados de 3-aminopirazol sustituidos

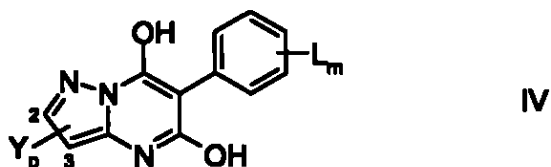
de la fórmula II, donde Y_p tiene las definiciones indicadas para la fórmula I según la reivindicación 1,



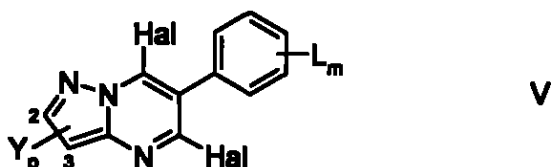
y 2-fenilmalonatos III



en dihidroxipirazolopirimidinas IV,



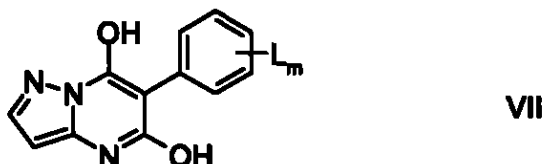
halogenación de IV dando halógenopirazolopirimidinas V



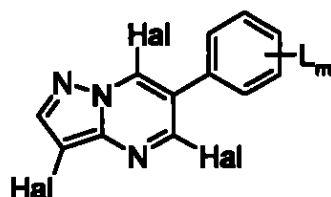
y transformación de V con aminas de la fórmula VI



- 9 Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en los que los grupos X e Y significan halógeno e Y se encuentra en la posición 3 del esqueleto de pirazolopirimidina, por halogenación de compuestos de la fórmula VII

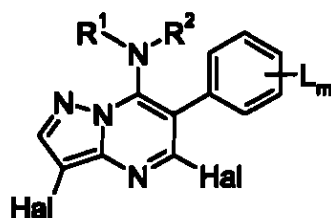


donde las variables tienen los significados indicados para la fórmula I y Hal representa un átomo de halógeno, trihalógenopirazolopirimidinas de la fórmula VIII



VIII

y transformación de VIII con aminas de la fórmula VI según la reivindicación 5 en compuestos de la fórmula I A

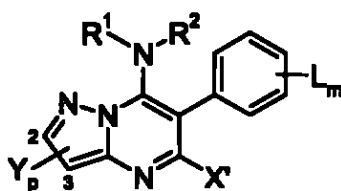


I.A

- 10 Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en los que X significa ciano, alcoxi C₁-C₆ o halógenoalcoxi C₁-C₂, por reacción de halógenopirazolopirimidinas de la fórmula I, donde X significa halógeno, con compuestos de la fórmula IX



donde X' es ciano, alcoxi C₁-C₆ o halógenoalcoxi C₁-C₂ y M es un catión amonio, tetraalquilamonio o un catión de metal alcalino o alcalinotérreo, dando compuestos de la fórmula I B

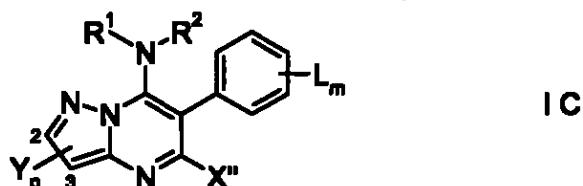


I B

- 11 Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en los que X significa alquilo C₁-C₄, por reacción de halógenopirazolopirimidinas de la fórmula I, donde X significa halógeno, con compuestos de la fórmula X

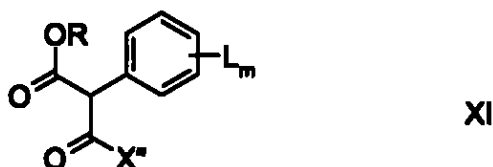


donde Xⁿ significa un grupo alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y M significa un ión de metal de la Y, especialmente, B, Zn o Sn, dando compuestos de la fórmula I C

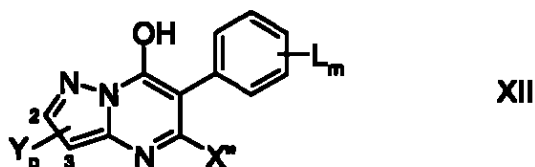


donde Xⁿ significa alquilo C₁-C₄, bajo catálisis de un metal transitorio, en un disolvente o diluyente inerte

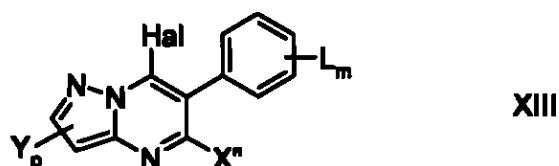
- 12 Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde X significa alquilo C₁-C₄, haciendo reaccionar 3-aminopirazoles sustituidos de la fórmula II según la reivindicación 5 con ceto ésteres de la fórmula XI,



donde R significa un grupo alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y Xⁿ significa alquilo C₁-C₄, dando hidroxipirazolopirimidinas de la fórmula XII

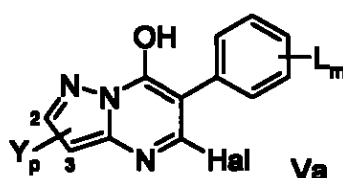


y halogenando XII en compuestos de la fórmula XIII,

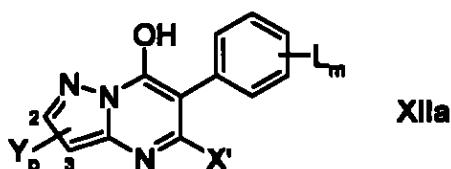


transformando XIII con aminas de la fórmula VI según la reivindicación 5 en compuestos de la fórmula I, donde X significa alquilo C₁-C₄

- 13 El procedimiento para preparar compuestos de fórmula I de acuerdo a la reivindicación 1 en donde X es CN o alcoxi C₁-C₄, por medio de la hidrólisis parcial de 5,7-dihalopirazolopirimidinas de la fórmula V de acuerdo con la reivindicación 5 con una solución acuosa de hidróxido de sodio para dar 5-halo-7-hidroxipirazolopirimidinas Va

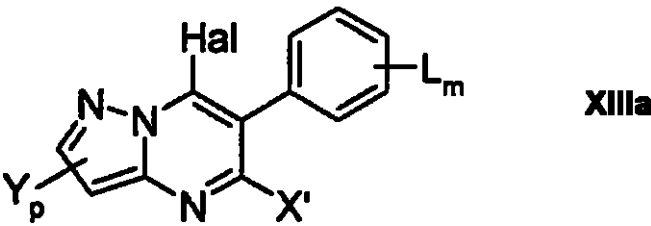


Va reacciona con compuestos organometálicos de la fórmula IX de acuerdo con la reivindicación 10 para dar compuestos de fórmula XIIa

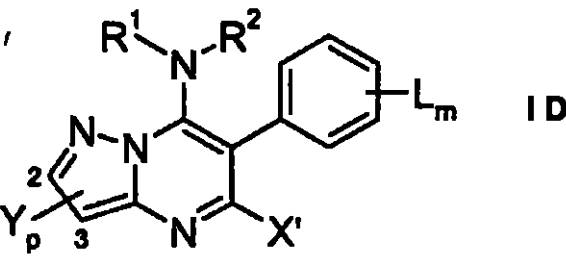


En donde X' es CN o alcoxi C₁-C₄ y M se define por la reivindicación 10, seguido por halogenación de XIIa para dar compuestos de la fórmula XIIIa

77



5 Y la reacción de los compuestos de la fórmula XIIIa con aminas de la fórmula VI de acuerdo con la reivindicación 8 para dar compuestos de la fórmula I D



10

14 Productos intermedios de las fórmulas IV, V, VIII, XII y XIII según las reivindicaciones 8, 9, 12 y 13

15 15 Producto apropiado para combatir hongos nocivos, que contienen un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1

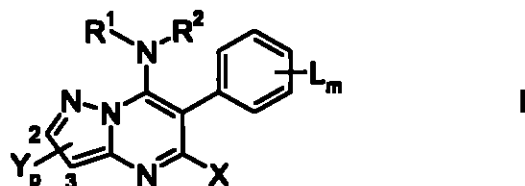
16 Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1

20

Pirazolopirimidinas sustituidas, procedimientos para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

Resumen

Pirazolopirimidinas sustituidas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes

L significa halógeno, alquilo, halógenoalquilo, alquenilo, alcoxi, amino, NHR, NR₂, ciano, S(=O)_nA¹ o C(=O)A², R es alquilo o alquilcarbonilo, A¹ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo, alquilamino o dialquilamino, n es 0, 1 ó 2, A² es alquenilo, alcoxi, halógenoalcoxi o uno de los grupos mencionados para A¹, m es 0 ó 1 hasta 5,

R¹ significa alquilo, halógenoalquilo, cicloalquilo, halógenocicloalquilo, alquenilo, alcadienilo, halógenoalquenilo, cicloalquenilo, alquinilo, halógenoalquinilo o cicloalquinilo, fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R² significa hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R¹,

✓✓

R^1 y R^2 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un átomo del grupo O, N y S,

donde R^1 y/o R^2 pueden estar sustituidos según la descripción,

X significa halógeno, clavo, alquilo, alcoxi o halógenoalcoxi,

Y significa alquilo, heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco a diez miembros según la descripción, o un grupo X u otro grupo según la descripción, p es 1 ó 2, pudiendo los grupos Y ser diferentes cuando $p = 2$, p es O, cuando X tiene los significados indicados en la descripción,

procedimientos y productos intermedios para la obtención de estos compuestos, productos que los contienen, así como el uso de los mismos para combatir hongos fitopatógenos

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

PCT/EP2004/005694

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 A01N43/98

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

B. FIELDS SEARCHED

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

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

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

EPD-Internal, PAJ, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2003, no 02, 5 February 2003 (2003-02-05) - & JP 2002 308879 A (NIPPON SODA CO LTD), 23 October 2002 (2002-10-23) cited in the application pages 6,14-23 page 25,, compound 4	1-16
P,X	WO 2004/000844 A (HILLEBRAND STEFAN ; KRUEGER BERND-WIELAND (DE); MAULER-MACHNIK ASTRID) 31 December 2003 (2003-12-31) claim 1	1-16
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 6 April 1998 (1998-04-08) claim 1	1-16

☐ 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

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

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

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

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

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

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

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

28 July 2004

Date of making of the international search report

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office P.B. 5018 Patentstr. 2
NL 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31 70) 340-2040, Tx. 31 851 epo nl,
Fax (+31 70) 340-2016

Authorized officer

Grassl, D

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

PCT/EP2004/005694

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 2002308879	A	23-10-2002	NONE	
WO 2004000844	A	31-12-2003	DE 10223917 A1 WO 2004000844 A1	11-12-2003 31-12-2003
EP 0834513	A	08-04-1998	US 5817663 A AT 221069 T DE 69714171 D1 DE 69714171 T2 EP 0834513 A2 JP 10152489 A US 5965561 A	06-10-1998 15-08-2002 29-08-2002 12-12-2002 08-04-1998 09-06-1998 12-10-1999

144

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2004/005694

Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

- 1 ☐ Claims Nos.
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely
- 2 ☐ Claims Nos.
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically
- 3 ☐ Claims Nos.
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 8.4(a)

Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows

see additional sheet

- 1 ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims
- 2 ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
- 3 ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.
- 4 ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims. It is covered by claims Nos.

1-9, 14-16 (alle Teil)

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

Continuation of Box III

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, as follows

- 1 Claims 1-9 and 14-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is F

- 2 Claims 1-9 and 14-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is Cl

- 3 Claims 1-9 and 14-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is Br

- 4 Claims 1-9 and 14-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is I

- 5 Claims 1-3, 6, 7, 10 and 13-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is cyano

- 6 Claims 1-4, 6, 7, 11, 12 and 14-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is C₁-C₄ alkyl

- 7 Claims 1, 2, 6, 7, 10 and 13-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is C₁-C₄ alkoxy
or C₁-C₄ halogen alkoxy

- 8 Claims 1, 2, 6, 7 and 14-16 (all in part)

Compounds as defined in claim 1 where X is OH

145

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM
GEBIET DES PATENTWESENS**

PCT

INTERNATIONALER VORLAUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054619	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/005694	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 27 05 2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 03 06 2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04 A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		
1 Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt 2 Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 7 Blätter einschließlich dieses Deckblatts ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70 16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften zum PCT) Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter		
3 Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten I ☒ Grundlage des Bescheids II ☒ Priorität III ☒ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfindersche Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 86 2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderschen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung VI ☒ Bestimmte angeführte Unterlagen VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 17 11 2004		Datum der Fertigstellung dieses Berichts 09 09 2005
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel +49 89 2399 0 Tx 523656 epmu d Fax +49 89 2399 4465		Bevollmächtigter Bediensteter Grassi D Tel +49 89 2399-8499 

146

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/005694

I. Grundlage des Berichts

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

Beschreibung, Seiten

1-43 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-16 in der ursprünglich eingereichten Fassung

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

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

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

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

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

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

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

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

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

**INTERNATIONALER VORLAUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT**

 Internationales Aktenzeichen **PCT/EP2004/005694**
6 Etwaige zusätzliche Bemerkungen
II Priorität

- 1 ☒ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da folgende angeforderte Unterlagen nicht innerhalb der vorgeschriebenen Frist eingereicht wurden
- ☒ Abschrift der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist
- ☐ Übersetzung der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist
- 2 ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da sich der Prioritätsanspruch als ungültig herausgestellt hat

Für die Zwecke dieses Bescheids gilt daher das obengenannte internationale Anmeldedatum als das maßgebliche Datum

3 Etwaige zusätzliche Bemerkungen
III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfindersche Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

- 1 Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderscher Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist
- ☐ die gesamte internationale Anmeldung,
- ☒ Ansprüche Nr 1-9, 14-16 (alle Teil)
- Begründung
- ☐ Die gesamte internationale Anmeldung, bzw die obengenannten Ansprüche Nr beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*)
- ☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie bitte nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr sind so unklar daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*)
- ☐ Die Ansprüche bzw die obengenannten Ansprüche Nr sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte
- ☒ Für die obengenannten Ansprüche Nr 1-9 14-16 (alle Teil) wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt
- 2 Eine sinnvolle internationale vorläufige Prüfung kann nicht durchgeführt werden, weil das Protokoll der Nukleotid- und/oder Aminosäuresequenzen nicht dem in Anlage C der Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard entspricht
- ☐ Die schriftliche Form wurde nicht eingereicht bzw entspricht nicht dem Standard
- ☐ Die computerlesbare Form wurde nicht eingereicht bzw entspricht nicht dem Standard

IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

148

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/005694

- 1 Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt
- ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet
- ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet
- ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet
- 2 ☐ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern
- 3 Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist
- ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist
- siehe Beiblatt
- 4 Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt
- ☐ alle Teile
- ☒ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. 1, 9, 14-16 (alle Teil) beziehen
- V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit, Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- 1 Feststellung
- | | | | |
|--------------------------------|------|-----------|-------------------------|
| Neuheit (N) | Ja | Ansprüche | 1, 9, 14-16 (alle Teil) |
| | Nein | Ansprüche | |
| Erfindersche Tätigkeit (IS) | Ja | Ansprüche | |
| | Nein | Ansprüche | 1-9, 14-16 (alle Teil) |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja | Ansprüche | 1-9, 14-16 (alle Teil) |
| | Nein | Ansprüche | |
- 2 Unterlagen und Erklärungen
- siehe Beiblatt
- VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- 1 Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)
- und / oder
- 2 Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)
- siehe Beiblatt

149

**INTERNATIONALER VORLAUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT - BEIBLATT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/005694

In diesem Bescheid werden die folgenden, im Recherchenbericht zitierten Dokumente (D) genannt, die Nummerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten

D1 JP2002308879

D2 EP 834 513

Zu Punkt III

Ansprüche, die sich auf Erfindungen beziehen, für die kein Internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, sind nicht Gegenstand des vorläufigen Prüfungsberichts (Regel 43bis 1(b) PCT in Verbindung mit Regel 66 1(e) PCT)
Daher bezieht sich dieser Bericht nur auf die erste Erfindung (vgl. Zu Punkt IV, Ansprüche 1-9, 14-16 (alle Teil))

Zu Punkt IV

Diese Behörde hat festgestellt, daß die internationale Anmeldung mehrere Erfindungen oder Gruppen von Erfindungen enthält, die nicht durch eine einzige allgemeine erfindensche Idee verbunden sind (Regel 13 1 PCT), nämlich

- I Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = F
- II Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = Cl
- III Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = Br
- IV Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = I
- V Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = Cyano
- VI Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = C1-C4-Alkyl
- VII Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = C1-C4-Alkoxy oder C1-C4-Halogenalkoxy
- VIII Verbindungen nach Anspruch 1 mit X = OH

Die Gründe dafür sind die folgenden

D1 stellt den nachstliegenden Stand der Technik dar und offenbart 5-Haloalkyl-Pyrazolopyrimidine als Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen. Die Kombination der

150

ersten Formel in der zweiten Spalte auf Seite 6 mit einer Vielzahl von Resten R2, R1 und Ln, wie sie auf den Seiten 14-23 und 25-27 aufgezeigt sind, führt zu Verbindungen, die sich von den vorliegenden Verbindungen lediglich durch das Halogenatom im 5-Haloalkyl-Rest unterscheiden. Ausserdem bezieht sich D1 auch auf Verbindungen, welche einen 2-Methyl oder 2-Pyridylrest aufweisen (vgl. Seite 6, letzte Formel linke Spalte und zweite Formel rechte Spalte im Zusammenhang mit den oben genannten Resten).

Weiterhin bezieht sich die D2 auf Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen, die ebenfalls das Strukturelement 7-Amino-6-phenyl-pyrazolo[1,5-a]pymidin aufweisen (vgl. Anspruch 1 aus D2, A ist CR7). Der vorliegende Anspruch 1 überlappt mit der durch Anspruch 1 aus D2 beschriebenen Gruppe von Verbindungen (A ist CR7, R7 = R4 = H).

Als technische Aufgabe der vorliegenden Anmeldung wird die Bereitstellung von alternativen Mitteln zur Bekämpfung von Schadpilzen gesehen.

Das Strukturelement 7-Amino-6-phenyl-pyrazolo[1,5-a]pymidin stellt das einzige technische Merkmal dar, das allen beanspruchten Gruppen von Verbindungen gemein ist. Da dieses Strukturelement bereits aus der D1 und der D2 bekannt ist, welche das gleiche technische Problem lösen, ist die erforderliche Einheitlichkeit der Erfindung (Regel 13.1 PCT) nicht mehr gegeben.

Zwischen den verschiedenen beanspruchten Gruppen von Verbindungen besteht kein technischer Zusammenhang im Sinne der Regel 13.2 PCT, der in einem oder mehreren gleichen oder entsprechenden besonderen technischen Merkmal zum Ausdruck kommt.

Zu Punkt V

Die folgenden Erwägungen beziehen sich nur auf die erste Erfindung (vgl. Zu Punkt IV oben).

- 1) Der Gegenstand der Ansprüche 1-9 und 14-16 (alle Teil) ist neu (Artikel 33(2) PCT).

Der Gegenstand der besagten Ansprüche wird als neue Auswahl aus D2 angesehen,

151

da die D2 keine Beispiele aufweist welche entweder ein Pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-Gerüst aufweisen oder mit Fluor substituiert sind (vgl. Zu Punkt IV, oben)

- 2) Der Gegenstand der Ansprüche 1-9 und 14-16 (alle Teil) beruht nicht auf einer erfindenschen Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)

Der Gegenstand des Anspruchs 1 besteht in der Auswahl einer Gruppe von Verbindungen aus dem in Dokument D2 beschriebenen Bereich (vgl. Anspruch 1 aus D2). Eine solche Auswahl kann jedoch nur dann als erfindensch angesehen werden, wenn die ausgewählte Gruppe von Verbindungen unerwartete Wirkungen oder Eigenschaften gegenüber dem Rest des Bereichs aufweist. Derartige Wirkungen oder Eigenschaften sind jedoch in der Anmeldung nicht angegeben. Dem Gegenstand der Ansprüche 1-9 (alle Teil) liegt daher keine erfindensche Tätigkeit zugrunde.

Der Gegenstand der Ansprüche 14-16 (alle Teil) wurde nur auf einer erfindenschen Tätigkeit beruhen, wenn dieses Erfordernis von Anspruch 1 erfüllt würde. Die 'wesentlichen strukturellen Unterschiede' zwischen den Beispielen der D2 und dem vorliegenden Anspruch 1 werden bei der Beurteilung der Neuheit berücksichtigt. Demgegenüber verweist die allgemeine Lehre der D2 (vgl. Anspruch 1) auch auf die vorliegenden Verbindungen. Daher kann eine erfindensche Tätigkeit nur beim Vorliegen von unerwarteten Wirkungen oder Eigenschaften anerkannt werden.



Expediente No		05122253	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			
Contiene OAR Final			

153

154

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Radicación 0308253 unidocub
Fecha (PMB) 2005-12-01 17:51:36
Trámite 011 PCI-PATENT 379, 026 MACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 026 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA 05 - 87,649
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 00361-891-066-0

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL
TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
Indicacion de que se solicita la concesion de una patente	()	()
Datos de Identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud	()	()
Descripción de la invencion	()	()
Dibujos de ser estos pertinentes	()	()
Comprobante de Pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA	()	()
INCOMPLETA	()	()
DISEÑO INDUSTRIAL	()	()
- Indicacion de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	()	()
- Representacion grafica o fotografica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño	()	()
Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA	()	()
INCOMPLETA	()	()
ESQUEMA DE TRAZADO	()	()
- Indicacion de que solicita el registro de un Esquema de trazado	()	()
Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud	()	()
Representacion grafica del esquema de trazado	()	()
Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA	()	()
INCOMPLETA	()	()

Firma Responsable

Fecha

Folio _____

2020
Bogotá DC

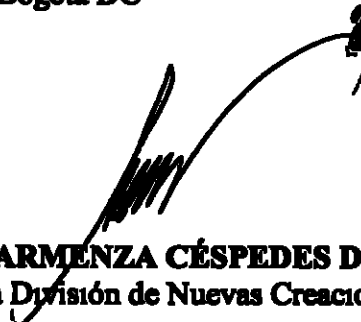
Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No	05-122253
	Solicitud Internacional	PCT/EP2004/005694
	Fecha inicio fase nacional	03-01-2006
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No	895
	Folios	001

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

Cúmplase
Dado en Bogotá DC

24 ENE 2006


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

202030