


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO
**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**
SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad..

☐ Capítulo I.

☒ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

 Nombre: **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de: República Federal de Alemania

 Dirección: 67056 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

 Domicilio: Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

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

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

 Número **438.019** T.P **31.929**

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

 1. **Frank SCHIEWECK**
Lindenweg 4,
67258 Hepheim,
República Federal de Alemania

 2. **Jordi TORMO I BLASCO**
Carl - Denz - str. 10-3,
69514 Laudenbach,
República Federal de Alemania

 3. **Carsten BLETNER**
Richard-Wagner-Strasse.48,
68166 Mannheim,
República Federal de Alemania

 4. **Bernd MÜLLER**
Stockingerstrasse. 7,
67227 Frankenthal,
República Federal de Alemania

 5. **Markus GEWEHR**
Goethestrasse. 21,
56288 Kastellaun,
República Federal de Alemania

 6. **Wassilios GRAMMENOS**
Alexander-Flöming-Strasse. 13,
67071 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

 7. **Thomas GROTE**
Im Hohnhausen 18,
67157 Wachenheim,
República Federal de Alemania

 9. **Joachim RHEINHEIMER**
Merziger Strasse.24,
67083 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

 10. **Peter SCHÄFER**
Römerstrasse. 1,
67308 Ottersheim
República Federal de Alemania

 11. **Anja SCHWÖGLER**
Heinrich-Lanz-Strasse. 3,
68166 Mannheim
República Federal de Alemania

 12. **Oliver WAGNER**
Im Meisental 50,
67433 Neustadt
República federal de Alemania

 13. **Siegfried STRATHMANN**
Donnersbergstrasse. 9,
67117 Limburgerhof
República Federal de Alemania

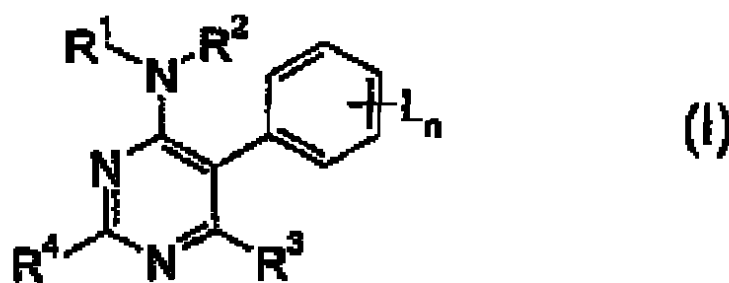
 14. **Ulrich SCHÖFL**
Erlenstr. 8,
68782 Brül,
República Federal de Alemania

 15. **Maria SCHERER**
Hermann-Jürgens-Strasse.30,
76829 Godramstein,
República Federal de Alemania

8. Andreas GYPSE B4.4, 68169 Mannheim, República Federal de Alemania		16. Reinhard STIERL Jahnstrasse 8, 67251 Freinsheim, República Federal de Alemania										
5 PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/007258</u> Fecha: <u>03 de julio de 2004</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2005/019187 A1</u> Fecha: <u>3 de marzo de 2005</u>												
6 TÍTULO (54) <u>PIRIMIDINAS 2-SUSTITUIDAS</u>												
7 Clasificación Internacional (51) <u>C07D 239/42</u>												
<table border="1"> <tr> <td rowspan="2">8</td> <td rowspan="2">Prioridad</td> <td>(33) País de Origen</td> <td>(32) Fecha</td> <td>(31) Número de Solicitud</td> </tr> <tr> <td>SI ☒ NO ☐</td> <td><u>DE</u></td> <td><u>24/07/2003</u></td> <td><u>103 33 857.8</u></td> </tr> </table>				8	Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud	SI ☒ NO ☐	<u>DE</u>	<u>24/07/2003</u>	<u>103 33 857.8</u>
8	Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha			(31) Número de Solicitud						
		SI ☒ NO ☐	<u>DE</u>	<u>24/07/2003</u>	<u>103 33 857.8</u>							
9 Comprobante de pago No.: <u>06 - 4.666</u> Fecha: <u>23 de enero de 2006</u>												
10 Anexos:												
☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes, si fuere el caso. ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☐ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidas en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud. ☒ Otros: <u>VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS</u>												

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente.

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA: *Emilio Ferrero*

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2005/019187 A1

Descripción:

Páginas 53 en el idioma original

Páginas 80 en español

Reivindicaciones: Número (s) 9

Figuras: Número (s)

2. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

U.R.Nr. 1407/89

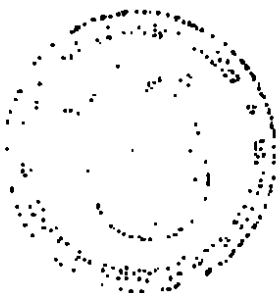
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorstehend
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren:

1. Dr. Gunther W e i 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 of Thomas Walter]

Th. Walter
Notar
am 17. März 1989
Notar des Amtsgerichts Ludwigshafen

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

Thomas Walter

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

[Handwritten signature of Franz Serfas]

(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM.

COMO NOTARIO RESIDE EN EL CIRCULO
DE SOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

LUZ GIMINIES DE ARREAR
17.03.89
Rev. 1. 1. 89

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

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (as)
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° 72-33, 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, anulándola 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 apoderados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y enseñas; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistír, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos hechos por agentes oficiales.

Dado y firmado hoy .. 17 de marzo de 1969

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

[Firma]
Firma

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° 72-33, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzern muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fälle der Hauptvertreter, oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten, oder kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittelst 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, beendeten, einer oder anderen, ordnungsgewissen werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Ausserdem, und unter denselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentum zu erhalten, und gegen den inlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck Ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie una vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder sonstiger Weise, oder haben mit Verwaltungsstreitigkeiten, oder juristischen Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erhaltung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Sammel-, Dienst- und Servicezeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen und -zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung; Namen und Wohnsitzänderung; freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragslizenzen; 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 vortreiben oder die man uns vortreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am 17. März 1969

in D-6700 Ludwigshafen

[Unterschrift]
Unterschrift

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

C E R T I F I C A:

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

El Cónsul General no asume responsabilidad por el
contenido del documento.

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

Frankfurt a. M. 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Don \$03.60 de Ley E. S. N. N.



M-0077

Marthe Niño de Staud
Marthe Niño de Staud
Cónsul General de Colombia

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

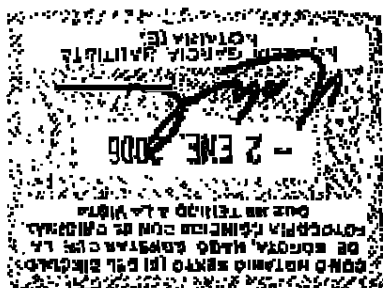
Regist. No. 85116

24 ABR. 1989

HADE EXTERIOR

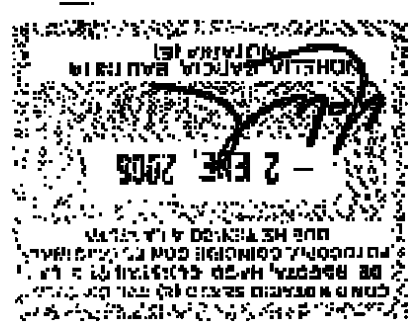
Of. el Sr. *Martha Nieto*
cuyo firma aparece al pie del presente
documento, compareció a la vista
de los señores de fe pública

Martha Nieto
NOTARIO MEXICO (E) EN CIRCULO
DE NOTARIA, HAGO CONSTAR QUE LA
FIRMA COINCIDE CON LA ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 2 ENE. 2006
Martha Nieto
NOTARIA PUBLICA
NOTARIA (E)



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según los artículos 13 del C. de M. C. y 400 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el señor Consul debe certificar que tuvo a la vista las pincas de su existencia, que aparece su objeto social, que quien otorga cumple el poder es su representante y puede otorgar poder, según lo menciona el artículo 13 del C. de M. C. y 400 del C. de Co.

Die konsularische Legalisierung ist notwendig.



COLOMBIA

COLOMBIA

TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

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

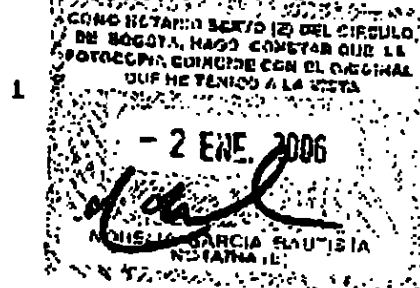
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

Protocolo notarial No. 1407/89

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

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

A los doctores Weizel y Richters los conozco en persona.



9.

... por haber tenido a la vista el registro de comer-
cio HR B 3000, del juzgado de Ludwigshafen, que los doctores
Wizel y Richter, en su calidad de apoderados, están facul-
tados para representar conjuntamente y firmar por la sociedad
BASIF Aktiengesellschaft, con sede en Ludwigshafen.

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989
(sello redondo)

Dr. Siegfried Kohler

Fdp.: firma ilegible

Notario de Ludwigshafen

Th. Walter

Asesor del notario como repre-
sentante oficialmente designado
del notario Dr. Siegfried Kohler

Se certifica la autenticidad de la firma anterior del asesor
del notario, conserjero de justicia Dr. Kohler, domiciliado en
Ludwigshafen am Rhein, y la del sello oficial que la acom-
paña. 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

2

COMO NOTARIO RENTU 19) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 2 ENE. 2006
[Firma]
[Sello]

REPRODUCCION
FOTOCOPIA
Verdadero No 299 Pl. 1989

El Presidente del Tribunal Regional

Firma: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Sartas)

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.
15061 del 24 de abril de 1989.

Pagada impuesto de timbre US\$ 6,00

EN TRADUCCIÓN FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en
los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA E INTERPRETE CIJUAL

Luz Arriaga de Herben

Resolución No. 599 Ministerio

COMO NOTARIO SEXTO (O DEL CIRCULO
DE BOGOTA, NAGO CONSTAR QUE YA
FOTOCOPIE CONSIDERE CON EL ORIGINAL
QUE ME TENDRO A LA VISTA

COPIA
BOGOTA, D.C.
MAYO 1989

Luz Arriaga de Herben

2 ENE. 2006

05 AGO. 1999

SANTO DOMINGO, D.R.



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá

28 FEB. 1985

No.

88000

HACE CONSTAR

Que el señor

LUZ DE HEPP

cuya firma aparece al pie del presente documento, desempeña en esa fecha

En las oficinas allí indicadas.

Encargado

CASO NOTARIO DONDE SE DEL CIRCUITO
DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

- 2 ENE. 2006

NOVELLA GARCIA BAUTISTA
NOTARIA (E)

DE LAS INSTRUCCIONES GENERALES
RECUERDE QUE TODOS LOS N

ESPALDO DEL BORRADOR DE ESTE FORMULARIO.
DEBEA ESTAR UNIFORMADO CON ALGUN VALOR EN CASO CONTRARIO, ESCRIBA CERO (0).

881051599954



DECLARACION Y PAGO DEL

IMPUESTO D

16 013 01 000045 1

TIMBR
NACIONAL

16 013 01 000045 1

1. Administración de Impuestos de:		Código:	2. Teléfono:
BOGOTA		0,3	2120100
3. Documento de identificación (marque X):		4. Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres):	
C.C. o T.I. ☐ NIT. ☒ No. 860041367 D.V. ☒		CAVELIER ABOGADOS	
5. C.C. o T.I. ☐ NIT. ☒ No. 19'301.829 C.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 cédula de:		Municipio:	Departamento:
Cra. 4a. No. 72-35		BOGOTA	CUNDINAMARCA
8. Relación al(los) tipo(s) de documento(s), indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción:			
TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989			
PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER			
COLO 6361-52-218-8			

REVISADO
SECCION DE CONTABILIDAD
IMPUESTOS NACIONALES

Firma	
Nombre:	
C.C. No. 17 216 2	

VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR		750
1. Servicios		0
2. Impuestos de timbre		0
3. Impuesto de Renta		750
4. Otros impuestos		0
TOTAL		750
Código de Verificación: 16 013 01 000045 1		
Firma y Sello del Contribuyente		
Firma: [Firma]		
Sello: [Sello]		
Fecha: 2 ENE. 2006		
Notario: FRANCIA BAUTISTA		
Notaría: [Sello]		

CONTRIBUYENTE

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No. 72 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MINEHA. CAVE

TELEFONO (571) 2720138

CABLES CAVELIERYS

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

Poderdante: BASE AKTIENGESELLSCHAFT

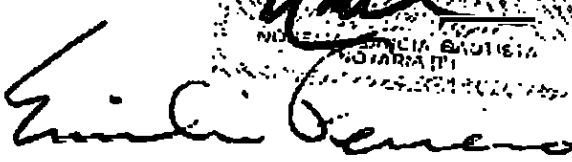
Poder conferido el: 17-03-89

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

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 85 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,

Acepto:


GERMAN CAVELIER
CON NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO
DE BOGOTÁ, QUE CONSTA QUE LA
T.P. ANOTADA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA.
C.C. No. 2.877.927 de Bogotá.
- 2 ENE. 2005

EMILIO FERRERO
NOTARIO (E)
BOGOTÁ (E)

EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-7H0-2

CON PRESENTACION PLÁSTICA

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circuito de San José de
Bogotá, comparecen, el Doctor Emilio F. PARRA

quien exhibe la cédula de notaría número 429.91
expedida en 4/12/64 y la cédula profesional
número 31.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento otorgado por R. D. MORAN (A. J. M.)
y declara que la firma que aparece en el c. p. p.

FIRMA AUTOGRÁFICA DEL DECLARANTE

- 6 OCT 1953

Societate de Bugată. D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



CON PRESENTACION PERSONAL

Art. 100. del Decreto 2' 82 de 1950!

Auto el Nattano Cincuenta (50) del Circolo da Santate del
Bogata, comparecio, di Doctor _____

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 2.577.924 expedida en 26 y la tarjeta profesional

expediente en 126
número 637 del Ministerio de Justicia, con
Diciembre 21 11

y declaro que la firma que aparece en él es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

Sanatate de Bogata, D. C.

01 OCT. 1993

AUTORIZO LA ANTERIOR

COMO NOTARIO BERTO LA SAL CUAL
ME HOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

- 2 ENE 2006

MANUELA GARCIA BUSTOZA
NOTARIA (E)



CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª Nº. 72-35
BOGOTÁ, B - COLOMBIA

0000054728

CESSION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmante(s)

I (we), the undersigned

Frank Schieweck /
Lindenweg 4, 67258 Hettheim
Germany
Citizen of Germany
Jordi Tormo i Blasco /
Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach
Germany
Citizen of Spain
Carsten Bleuner /
Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller /
Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr /
Goethestr. 21, 56288 Kastellan
Germany
Citizen of Germany
Wassilios Grammenos /
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Thomas Grote /
Im Hühnhaus 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
Andreas Gypser /
B 1, 4, 68159 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Joachim Rheinheimer /
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
Peter Schäfer /
Römersstr.1, 67308 Quersheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

CAVELIER ABOGADOS
WFOUJRE-343

177 Andromeda Drive, C11, L-88

Anja Schwöglér ✓
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Oliver Wagner ✓
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
Siegfried Strathmann ✓
Donnersburgstr. 9, 67117 Linburgerhof
Germany
Citizen of Germany
Ulrich Schöff ✓
Erdmule 8, 67552 Brühl
Germany
Citizen of Germany
Maria Scherer ✓
Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Gadenheim
Germany
Citizen of Germany
Reinhard Stierl ✓
Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany

✓ declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)
inventor(es) de la invención:

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

Pyrimidinas 2-Substituiertes

2-Substituted pyrimidines

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

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

BASF Aktiengesellschaft

BASF Aktiengesellschaft

constituida y existente de conformidad con las leyes de

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Allemagne

Germany

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Alemania

67056 Ludwigshafen, Germany

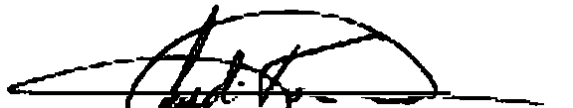
todos los derechos inherentes a dicha invención y que la
citada Compañía queda facultada para solicitar en su
nombre la patente correspondiente en la República de
Colombia.

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 19. Juli 2004

Firma Signature

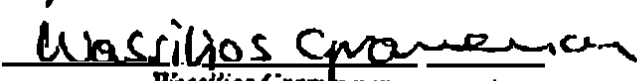

Frank Schirweck


Jodi Tormo i Blasco


Carsten Blettner

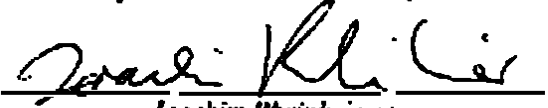

Bernd Müller

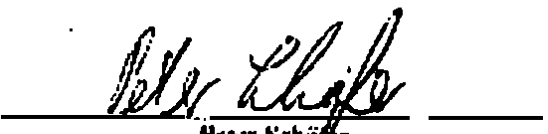

Markus Bewehr


Wassilios Grammenos


Thomas Girdle


Andreas Gypser


Joachim Rheinwimmer


Peter Schüßler

Anja Schwögl

Anja Schwögl

Oliver Wagner

Oliver Wagner

Siegfried Struthmann

Siegfried Struthmann

Ulrich Schöff

Ulrich Schöff

Marius Scherer

Marius Scherer

Reinhard Stierl

Reinhard Stierl

Urk.R.Nr. 1630/2004

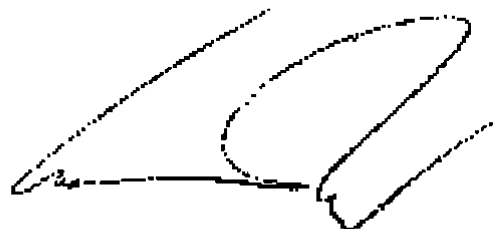
I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

1. M. Frank **Schieweck**, residing at Lindenweg 4, 67258 Reßheim, Germany, personally known to me,
2. Mr. Jordi **Torno i Blasco**, residing at Carl-Benz-Straße 10-3, 69514 Landenbach, , Germany, personally known to me,
3. Mr. Carsten **Blottner**, residing at Richard-Wagner-Straße 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
4. Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
5. Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestraße 21, 56280 Kastellaun, Germany, personally known to me,
6. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
7. Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Hühnhaus 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
8. Mr. Andreas **Gypser**, residing at B 4, 4, 68159 Mannheim, Germany, personally known to me,
9. Mr. Joachim **Rheinheimer**, residing at Merziger Straße 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
10. Mr. Peter **Schäfer**, residing at Römerstraße 1, 67308 Ottersheim, Germany, personally known to me,
11. Mrs. Anja **Schwöglar**, residing at Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
12. Mr. Oliver **Wagner**, residing at Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Germany, personally known to me,

- 18
13. Mr. Siegfried **Strathmann**, residing at Donners-
bergstraße 9, 67117 Limburgerhof, Germany, perso-
nally known to me,
 14. Mr. Ulrich **Schöfl**, residing at Erlenstr. 8,
68782 Brühl, Germany, personally known to me,
 15. Mrs. Maria **Scherer**, residing at Hermann-Jürgens-
Straße 30, 76829 Godramstein, Germany, personally
known to me,
 16. Mr. Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstraße 8,
67251 Freinsheim, Germany, personally known to
me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 13th day of July, 2004



Notary Public

Wert: 5.112,92 Euro

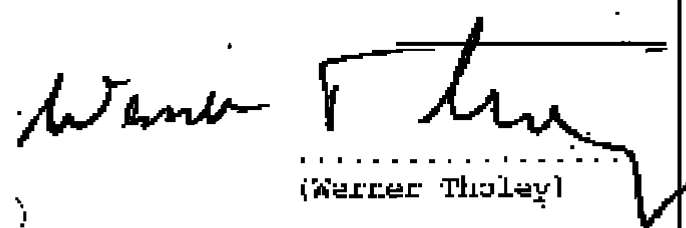
A P O S T I L L E

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 9. August 2004
7. durch den Präsidenten des Landgerichtes
8. unter Nr. 91 Ib - 932-995/04
9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift


.....
(Werner Tholey)

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUAL)

A los _____ días del mes de _____ de 200...

dist: mi, Notario Público de

အမျိုးမျိုး (၁၀၀) ပါဝင်ပါသည်။

NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

On this 19th day of July 2004

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

personally appeared

Frank Schlaweck, Jordi Tormo i Blasco,
Carsten Blattner, Bernd Müller,
Markus Gewehr, Naxxilion Grammenos,
Thomas Grote, Andreas Gypser,
Jochim Rheinheimer, Peter Schäfer,
Anja Schwöglar, Oliver Wagner,
Siegfried Strathmann, Ulrich Schöffl,
Maria Scherer and Reinhard Stierl

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

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



Notario Público

Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille.

6 CARTIER ABOGADOS
VERGARA 71

WFOCE-KF-717

לשכת הבריאות העולמית

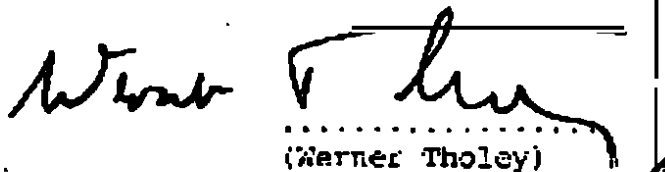
A P O S T I L E

(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 9. August 2004
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb. 922-995/04
9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift


.....
(Werner Tholey)

Kostenvermerk:
Gebühr 12.-- €

TRADUCCION OFICIAL No. 11912

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber,
resolución del Ministerio de Justicia 599 del 5 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

- Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach
Alemania
Ciudadano de España
- Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str.48, 68165Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Bernd Müller
Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56286 Kastellaun
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Grecia
- Thomas Grote
Im Hühnhaus 18, 67157 Wachenheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Andreas Gypser
B 4, 4, 68159 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Alemania
- Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

Luz Arriaga de Herber
Traductora e Interpret Oficial

Resolución del Ministerio de Justicia

Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Alemania
Ciudadano de Alemania
Siegfried Stralimann Donnersbergstr. 9, 67117 Linburgerhof
Alemania
Ciudadano de Alemania
Ulrich Schöff
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Alemania
Ciudadano de Alemania
Marla Scherer
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein
Alemania
Ciudadano de Alemania
Reinhard Stierl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

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

Primidinas 2-sustituidas

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Hay dieciséis firmas ilegibles. Dado y firmado el 19 de julio 2004.

Autenticación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio 2004, bajo el No.1630/2004. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros

LUZ ABRIAGA DE HERRERA
TRADUCCIONALES INTERPRETES OFICIALES

Resolución No.599 Ministerio

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer

3. Actuando en calidad de notario público

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

5. en Frankenthal (Pfalz)

6. el 9 de agosto 2004

7. por el Presidente del Tribunal Regional

8. bajo el No. 91 Eb - 922-995/04

9. Sello

(Hilo y oblaa del Tribunal Regional)

10. Firma

Fdo.: firma ilegible

(Werner Tholey)

Costas:

Derechos 12,00 €

Autenticación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio 2004. Fdo.: firma ilegible.- Sello redondo en tinta - Ludwig Draxel-Fischer - Notario de Ludwigshafen am Rhein.

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer

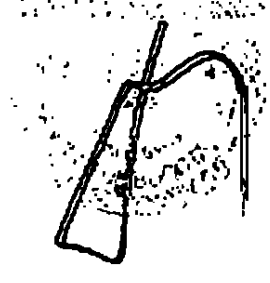
ELI ARANDA DE HERRERA
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No. 593 del 14/01/03

INSTITUTO MEXICANO DEL NOTARIO PUBLICO
 INSTITUTO MEXICANO DEL NOTARIO PUBLICO
Luz Arriaga de
Herber
 NOTARIO PUBLICO REGISTRADO EN
 EL ESTADO DE TAMPAQUECO
 10/11/2003

NO SE ASUME
 RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
 2003 MAR 10 P 1:02
Luz
 DIRECCION DE REGISTROS
 SECRETARIA DE JUSTICIA

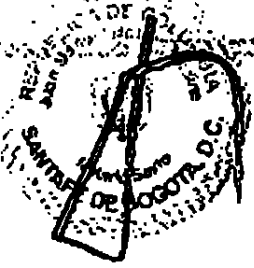
MINISTERIO DE
 RELACIONES EXTERIORES
 498973
Luz Arriaga
 SECRETARIA DE JUSTICIA
 DIRECCION DE REGISTROS
 SECRETARIA DE JUSTICIA



ARTÍCULO SEPTIMO DE LA CONSTITUCION DE
LA REPUBLICA DE COLOMBIA (S) FIRMAS (S) DE

Luz Arriaga
de Herber

CON LA FIRMA REGISTRADA POR
(S) EN ESTA NOTARIA
10ENE2006



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 FEB 10 2 14:02

Luz
Jefe de Legaciones
BOGOTÁ D.C.

INTERIOR DE
LA OFICINA EXTERIORES

02974
Luz Arriaga
Jefe de Legaciones
BOGOTÁ D.C.

3. Actuando en calidad de notario público
4. Lleva el sello oficial del notario Draxel-Fischer,
notario de Ludwigshafen am Rhein

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 9 de agosto 2004
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb - 922-995/04
9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma
Fdo.: firma ilegible
(Werner Tholey) ..

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, 04 de enero 2005

C 3210

LUZ ARRIAGA DE HERRER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Luz Arriaga de Herrero
Resolución No. 599 del 2004

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 03.01/06 preparada por María Elvira Martelo, traductora oficial aprobada por el Ministerio de Justicia mediante resolución 2879 de 1999 y reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores.

Colombia

0000054728

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones otorgados en inglés en un documento de Cesión de Inventores a la sociedad **BASF AKTIENGESELLSCHAFT** firmado en inglés y español el 19 de julio de 2004:

Urk.R.Nr. 1630/2004

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. Sr. Frank **Schleweck**, residente en Lindenweg 4, 67258 Hetsheim, Alemania, conocido personalmente por mí,
2. Sr. Jordi **Tormo i Blasco**, residente en Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania, conocido personalmente por mí,
3. Sr. Carsten **Blettner**, residente en Richard-Wagner-Straße 48, 68165 Mannheim, Alemania, conocido personalmente por mí,
4. Sr. Bernard **Müller**, residente en Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Alemania, conocido personalmente por mí,
5. Sr. Markus **Gewehr**, residente en Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Alemania, conocido personalmente por mí,
6. Sr. Wassilios **Grammenos**, residente en Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, conocido personalmente por mí,
7. Sr. Thomas **Grote**, residente en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, conocido personalmente por mí,
8. Sr. Andreas **Gypser**, residente en B 4, 4, 68159 Mannheim, Alemania, conocido personalmente por mí,
9. Sr. Joachim **Rheinheimer**, residente en Merziger Straße 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, conocido personalmente por mí,

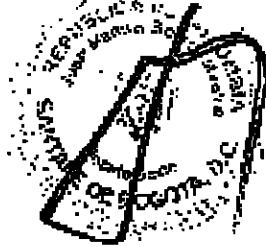
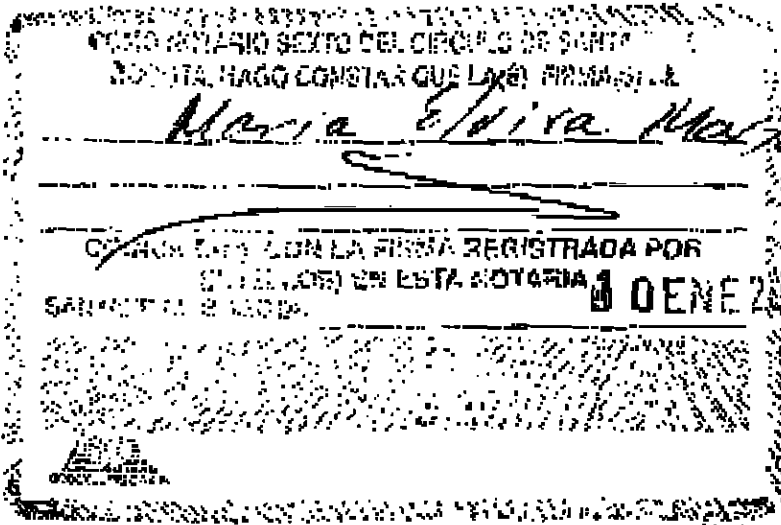
MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

402975
Maria Elvira Martelo
CONFECCION DE PASAPORTE
DOCUMENTOS DE EMBAJADA
ASISTENCIAS INDICADAS

HA SE ACEPTA
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 ENE 10 P 1:02

Uso
Jefe de LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.



10. Sr. Peter Schäfer, residente en Römerstraße 1, 67308 Ottersheim, Alemania, conocido personalmente por mí,
11. Sra. Anja Schwöglar, residente en Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania, conocido personalmente por mí,
12. Sr. Oliver Wagner, residente en Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania, conocido personalmente por mí,
13. Sr. Siegfried Strathmann, residente en Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, conocido personalmente por mí,
14. Sr. Ulrich Schöfl, residente en Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania, conocido personalmente por mí,
15. Sra. Maria Scherer, residente en Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Godramstein, Alemania, conocida personalmente por mí,
16. Sr. Reinhard Stierl, residente en Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania, conocido personalmente por mí,

son genuinas y válidas.

Ludwigshafen/Rhine, 19 de julio de 2004

(Firma ilegible), Notario Público

Apostilla otorgada en Alemán el 9 de agosto de 2004 bajo el No. 91 Eb-922-995/04, firmada por Werner Tholey.

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (INDIVIDUO)

Hoy, 19 de julio de 2004, ante mí, un Notario Público de Ludwigshafen, República Federal de Alemania, comparecieron personalmente Frank Schieweck, Jordi Tormo i Blasco, Carsten Blettner, Bernd Müller, Markus Gewehr, Wassilios Grammenos, Thomas Grote, Andreas Gypser, Joachim Rheinheimer, Peter Schäfer, Anja Schwöglar, Oliver Wagner, Siegfried Strathmann, Ulrich Schöfl, Maria Scherer y Reinhard Stierl, conocidos por mí y me consta que son las personas que ejecutaron el documento que precede y tienen capacidad legal para otorgarlo.

(Firma ilegible), Notario Público

Sello del Sr. Ludwig Draxel-Fischer

Maria Elvira Mastelo
TRADUCCION No. 03.0106
MARIA ELVIRA MASTELO
 Traductora e Intérprete Oficial
 Inglés - Español Inglés
 Reg. No. 2877 Min. Justicia

Apostilla otorgada en Alemán el 9 de agosto de 2004 bajo el No. 91 Eb-922-995/04,
firmada por Werner Tholey.

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

COLO 00361-841-076-9

WPCL 0361 - ID 4322

ENE 04/06

Maria E. Martelo
TRADUCCIÓN No. 03.01.06
MARIA ELVIRA MARTELO
Traductora e Interprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Res. No. 2879 Min. Justicia

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
3. März 2005 (03.03.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/019187 A1

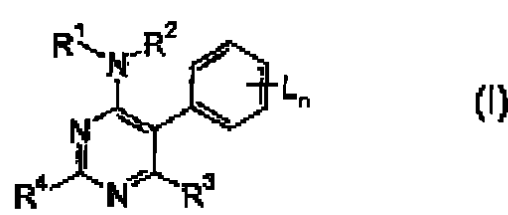
- (51) Internationale Patentklassifikation: C07D 239/42
- (31) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/007258
- (22) Internationales Anmeldedatum: 3. Juli 2004 (03.07.2004)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität: 169 33 857.3 24. Juli 2003 (24.07.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsgebiete mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT (DE/DE); 67056 Ludwigshafen (DE).
- (72) Erfinders und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHIEWECK,

Frank (DE/DE); Linderweg 4, 67258 Hainstein (DE).
TORMO I BLASCO, Jordi (ES/DE); Carl-Benz-Strasse
10-3, 69514 Landeshoch (DE). MERTINER, Carsten
(DE/DE); Richard-Wagner-Strasse 49, 68165 Mannheim
(DE). MÜLLER, Bernd (DE/DE); Stockingerstrasse 7,
67227 Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus (DE/DE);
Guelthstrasse 2b, 56283 Kastellum (DE). GUAN-
MENON, Waddeen (IN/DE); Alexander-Hanning-Strasse
13, 67071 Ludwigshafen (DE). GRÖBLER, Thomas
(DE/DE); Im Hühnerhausen 18, 67157 Wüchtersheim (DE).
GYPSER, Andreas (DE/DE); B 4, 68159 Mannheim
(DE). RHEINHEIMER, Joachim (DE/DE); Merzinger
Strasse 24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER,
Peter (DE/DE); Rönnestrasse 1, 67308 Ottersheim (DE).
SCHWÖGLER, Anja (DE/DE); Heinrich-Lenz-Strasse
3, 68163 Mannheim (DE). WAGNER, Oliver (DE/DE);
Im Meisenhof 50, 67433 Neustadt (DE). STRATHMANN,

(Fortsetzung auf der nächsten Seite)

(54) Title: 2-SUBSTITUTED PYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: 2 SUBSTITUIERTEN PYRIMIDINE



(57) Abstract: The invention relates to 2-substituted pyrimidines of formula (I), in which the index n and the substituents R¹, R² and R³ are defined as cited in the description. R⁴ is defined as follows: R⁴ corresponds to one of the formulae (II), in which X represents a direct bond, -(C=O)-, -(C=O)-NH-, -(C=S)-O-, -O-, -NR⁵-, whereby the respective molecule on the left is bonded to the nitrogen atom. R⁴ represents hydrogen, methyl, benzyl, trifluoromethyl, allyl, propargyl or methoxymethyl; R⁵ represents hydrogen, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₆ alkenyl; R⁶ represents hydrogen, methyl, or C₁-C₄ alkyl; and Z represents S or NR⁶. The aliphatic groups of the radical definitions of R¹, R² and/or R³ can in turn carry one or two groups R⁷, whereby R⁷ represents halogen, OR⁸, NHOR⁸, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxyalkyl, C₁-C₄ neylamino, [1,3]dioxolane-C₁-C₄ alkyl, [1,3]dioxane-C₁-C₄ alkyl and R⁸ represents hydrogen, methyl, allyl or propargyl. The invention also relates to a method for producing said compounds, to agents containing said

compounds and to the use of the latter as pesticides.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft 2-substituierte Pyrimidine der Formel (I), in der der Index n und die Substituenten R¹, R² und R³ wie in der Beschreibung definiert sind und R⁴ die folgende Bedeutung hat: R⁴ einer der Formeln (II) entspricht, in denen X eine direkte Bindung, -(C=O)-, -(C=O)-NH-, -(C=S)-O-, -O-, -NR⁵-, wobei der jeweils linke Molekülteil an das Stickstoffatom gebunden ist; R⁴ Wasserstoff, Methyl, Benzyl, Trifluormethyl, Allyl, Propargyl oder Methoxymethyl; R⁵ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; R⁶ Wasserstoff, Methyl oder C₁-C₄-Aryl; Z S oder NR⁶, bedeutet, wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von R¹, R² und/oder R³ ihrerseits eine oder zwei Gruppen R⁷ tragen können: R⁷ Halogen, OR⁸, NHOR⁸, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl, C₁-C₄-Acyloxyamin, [1,3]Dioxolano-C₁-C₄-alkyl, [1,3]Dioxano-C₁-C₄-alkyl, wobei R⁸ Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl bedeutet. Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, Mittel enthaltend diese Verbindungen und deren pestizide Verwendung.

WO 2005/019187 A1

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

402876
Maria Martelo
COPIA DEL ORIGINAL DEL
DOCUMENTO QUE SE ENVIÓ
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 ENE 10 P 1:02

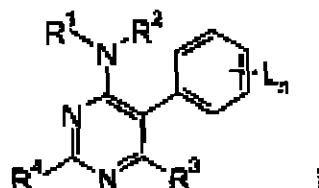
USO DE LEY
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTO SPIRITO
JUSTO. HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE
Maria Elvira Martelo
CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTO SPIRITO, 10 ENE 2006



2-Substituted pyrimidines

The invention relates to 2-substituted pyrimidines of the formula I



in which the index and the substituents are as defined below:

n is an integer from 1 to 5;

L is halogen, cyano, cyanato (OCN), C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkyl, C₄-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₄-C₆-cycloalkenyloxy, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A or S(=O)_m-N(A')A,

m is 0, 1 or 2;

A, A', A'' independently of one another are hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₄-C₆-cycloalkenyl, phenyl, where the organic radicals may be partially or fully halogenated or may be substituted by nitro, cyanato, cyano or C₁-C₄-alkoxy; or A and A' together with the atoms to which they are attached are a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic hetero cycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S;

where the aliphatic groups of the radical definitions of L for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to four groups Rⁿ:

Rⁿ is cyano, C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-cycloalkyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₄-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₄-C₆-cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A,

R¹, R² independently of one another are C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, where the aliphatic

2

groups of the radical definitions of R^1 and R^2 may for their part be partially or fully halogenated or may carry one to four groups R'' :

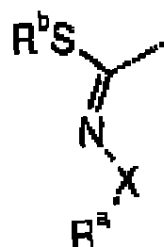
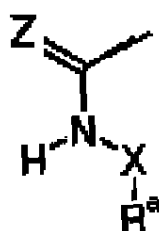
5 R'' is cyano, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_4 - C_8 -cycloalkenyl, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_2 - C_8 -alkenyloxy, C_2 - C_8 -alkynyloxy, C_3 - C_8 -cycloalkyloxy, C_4 - C_8 -cycloalkenyloxy, C_1 - C_8 -alkylthio, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A') (=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ or $S(=O)_m-N(A')A$ or phenyl, where the phenyl moiety may carry one to three radicals selected from the group consisting of halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_8 -halogenalkyl, C_1 - C_8 -alkoxy, cyano, nitro, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A') (=N-OA)$, $N(A')A$;

15 R^2 may additionally be hydrogen;

R^1 and R^2 may also, together with the nitrogen atom to which they are attached, form a saturated or unsaturated five- or six-membered ring which may be interrupted by an ether ($-O-$), carbonyl ($C=O$), thio ($-S-$), sulfoxyl ($-S(=O)-$) or sulfanyl ($-SO_2-$) or a further amino ($-N(R^3)-$) group where R^3 is hydrogen or C_1 - C_6 -alkyl and/or may contain one or more substituents from the group consisting of halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_3 -haloalkyl and oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy;

25 R^5 is halogen, cyano, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_2 - C_4 -alkenyloxy, C_2 - C_4 -alkynyloxy, C_1 - C_3 -alkylthio, di- $(C_1$ - C_6 -alkyl)amino or C_1 - C_6 -alkylamino, where the alkyl, alkenyl and alkynyl radicals of R^5 may be substituted by halogen, cyano, nitro, C_1 - C_2 -alkoxy or C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl;

30 R^4 corresponds to one of the formulae



where

3

- X is a direct bond, $-(C=O)-$, $-(C=O)-NH-$, $-(C=O)-O-$, $-O-$, $-NR^c$, where the molecule moiety to the left in each case is attached to the nitrogen atom;
- 5 R^a is hydrogen, methyl, benzyl, trifluoromethyl, allyl, propargyl or methoxymethyl;
- R^b is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkynyl;
- 10 R^c is hydrogen, methyl or C_1-C_4 -acyl and
- Z is S or NR^d ;
- 15 where the aliphatic groups of the radical definitions of R^a , R^b and/or R^c for their part may carry one or two groups R'' ;
- R'' is halogen, OR^e , NHR^e , C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxycarbonyl, C_1-C_4 -acylamino, [1,3]dioxolane- C_1-C_4 -alkyl, [1,3]dioxane- C_1-C_4 -alkyl, where
- 20 R^e is hydrogen, methyl, allyl or propargyl.

Moreover, the invention relates to a process for preparing these compounds, to compositions comprising them and to their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

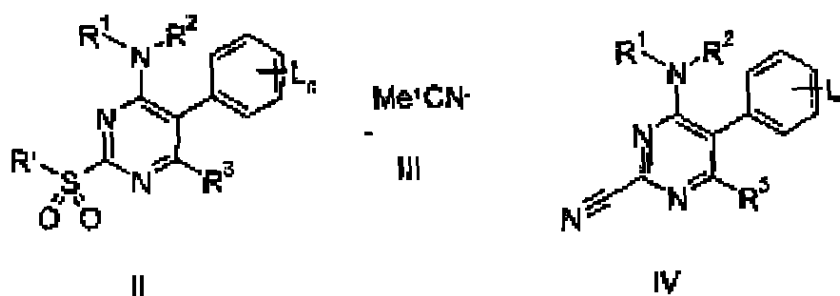
- 25 Fungicidal pyrimidines carrying a cyanamino substituent in the 2-position are known from WO-A 01/96314. Furthermore, fungicidal pyrimidines carrying, inter alia, an amide radical in the 2-position are known from WO-A 03/43993.

- 30 However, in many cases the activity of the abovementioned pyrimidines is unsatisfactory. It is an object of the present invention to provide compounds having improved activity.

- 35 We have found that this object is achieved by the pyrimidines of the formula I defined at the outset. Moreover, we have found processes for their preparation and compositions comprising them for controlling harmful fungi.

The compounds I can be obtained by different routes.

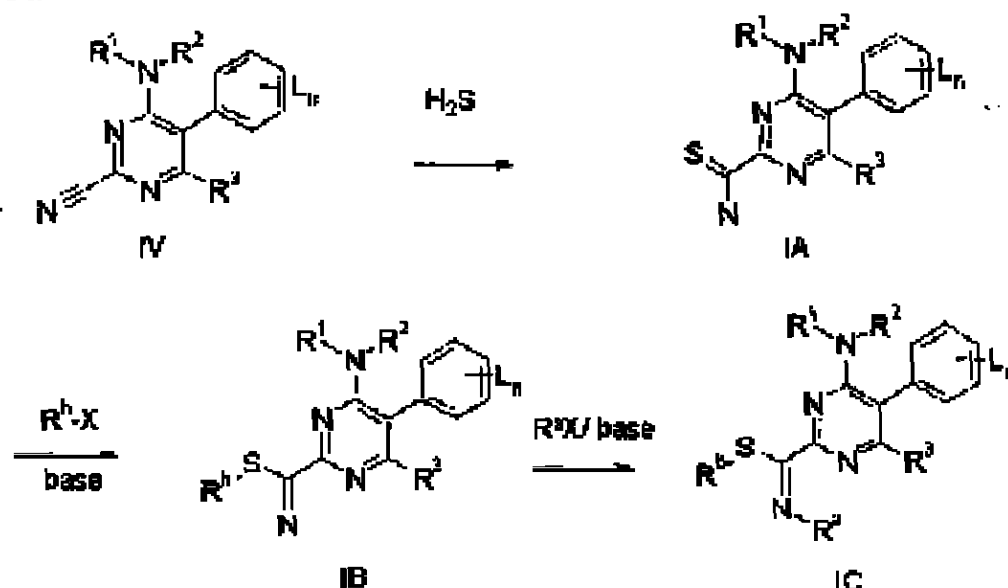
It is possible, for example, to use sulfones of the formula II whose preparation is described in detail in WO-A 02/074753 or DE 10156279.9 and where R' is an unsubstituted or substituted C₁-C₄-alkyl radical or an unsubstituted or substituted phenyl radical as starting materials. Reaction of the sulfones II with metal cyanides III (Me'CN) yields the nitriles IV. Metal cyanides are to be understood as meaning primarily alkali metal cyanides or alkaline earth metal cyanides or else covalent cyanides, such as tin tetra-



The exchange of the sulfonate group for the nitrile group is carried out by methods known from the literature, as described, for example, in WO-A 03/043993.

The further synthesis can be carried out as shown in Scheme 1:

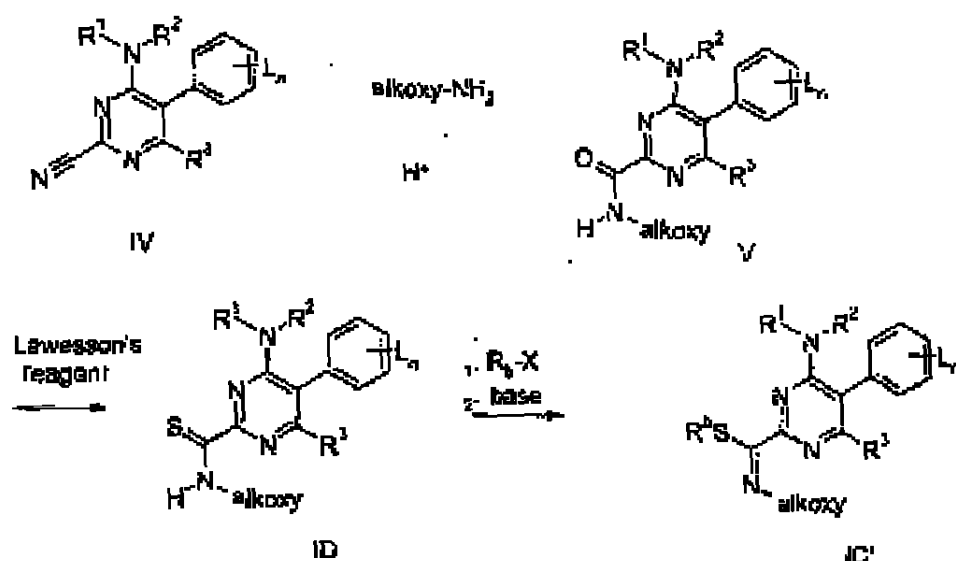
Scheme 1:



- Using hydrogen sulfide, preferably under acidic conditions, the nitrile compound IV can be thiolized to give thioamide IA. The thiolysis is carried out under the conditions of the Pinner reaction (see Preparation Examples). Alkylation with R^b-X, where R^b is as defined above and X is a leaving group, such as halide, sulfate or sulfonate, affords compounds of type IB. A further alkylation step with R^a-X, where R^a is, for example, C₁-C₈-alkyl and X is a leaving group, such as halide, sulfate or sulfonate, yields compounds of type IC. The two alkylations mentioned above can also be carried out using Meerwein salts of the formula (R^b)₃OBf₄, analogously to the procedures given in Synth. Commun. 13, (1983), 753 or Helv. Chim. Acta 69, (1986), 1224.

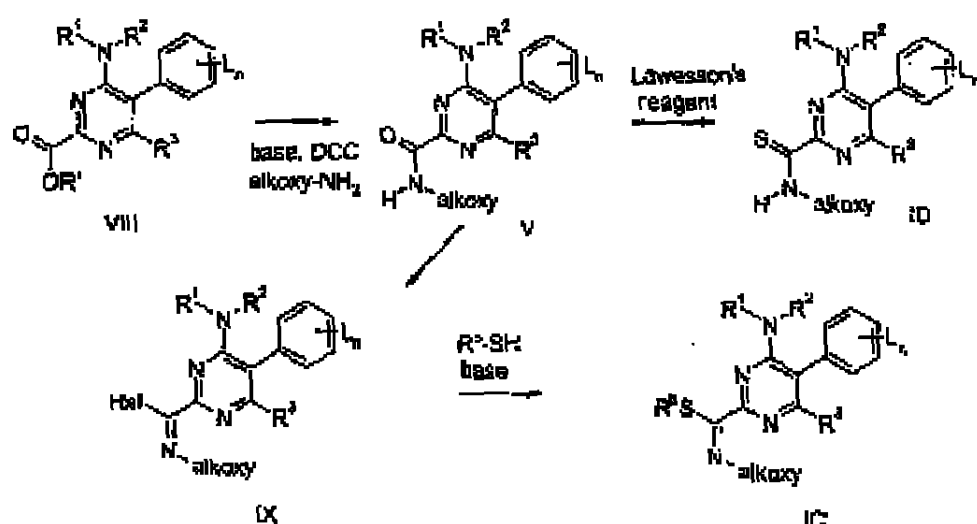
- Compounds IC' according to the invention in which R^a is a C₁-C₈-alkoxy substituent can be obtained as shown in Scheme 2.

Scheme 2:



- Starting with nitrile IV and using a C₁-C₈-alkoxyamines, the hydroxamic acid derivative V is obtained under acidic conditions. Conversion into the thione compound ID can be realized using, for example, phosphorus pentasulfide or Lawesson's reagent. Compounds IC' according to the invention can be obtained by alkylation with R³-X, where R³ is as defined above and X is a leaving group, such as halide, sulfonate or sulfate.
- 5
- 10 An alternative synthesis of the compounds IC' and ID according to the invention is shown in Scheme 3.

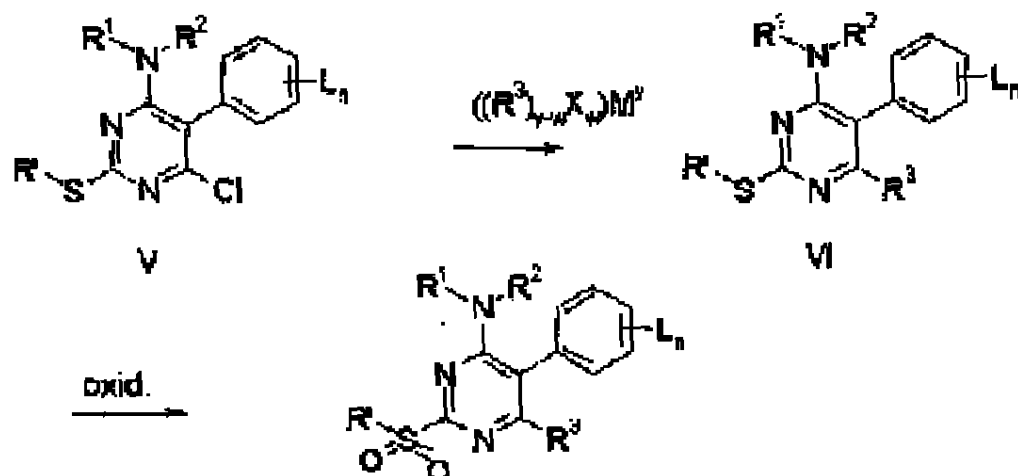
Scheme 3:



- In the synthesis, shown in Scheme 3, of compounds IC' and ID, the starting material used is the ester of the formula VIII. Reaction of VIII with hydroxylamines to give hydroxamic acids V can be carried out as described in Org. Lett. 3 (2001), 1053-56 or in J. Org. Chem. 85 (2000), 8415-20. The subsequent sulfurization can be carried out analogously to Aust. J. Chem. 41 (1988), 37. The imino-halides of the formula IX where Hal is halogen and in particular chlorine and bromine can be obtained analogously to Synthesis 9 (1991), 750-752. In an Appel reaction using, for example, carbon tetrabromide and triphenylphosphine, the corresponding bromine compounds are prepared. The latter can finally be reacted with mercaptans of the formula R³SH and bases to give the compounds IC' according to the invention.
- The radical R³ (in particular alkyl) in the 6-position on the pyrimidine ring can be introduced by reaction with transition metal catalysis, such as Ni or Pd catalysis. In some cases it may be advisable to change the order and to introduce substituent R³ first and then substituent NR¹R².

8

Scheme 4:



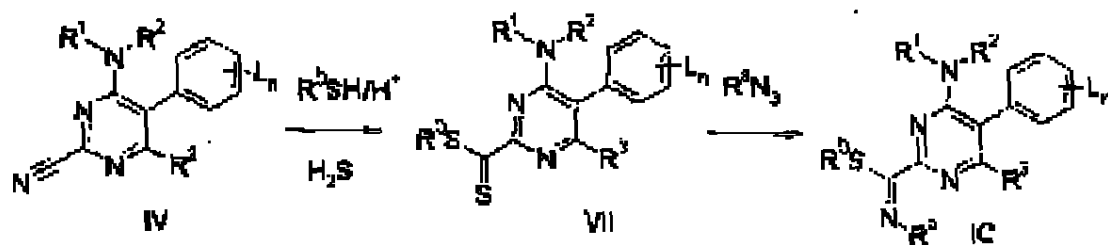
- In the formula $(\text{R}^3)_w\text{X}_y\text{M}^v$, M is a metal ion of valency Y, such as, for example, B, Zn, Mg, Cu or Sn. X chlorine, bromine, iodine or hydroxy, R^3 is preferably C_1 - C_4 -alkyl and w is a number from 0 to 3. This reaction can be carried out, for example, analogously to the following methods: J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 (1994), 1187; *ibid.* 1 (1996), 2345; WO-A 99/41255; Aust. J. Chem. 43 (1990); 733; J. Org. Chem. 43 (1978), 358; J. Chem. Soc., Chem. Commun. (1979), 866; Tetrahedron Lett. 34 (1993), 8267; *ibid.* 33 (1992), 413. In the formulae mentioned above, R^1 is in particular unsubstituted or substituted C_1 - C_6 -alkyl or unsubstituted or substituted phenyl.

Pyrimidines which carry a radical R^4 in the 2-position:



- where R^3 is alkyl, alkenyl, alkynyl or cycloalkyl can also be prepared, for example, by the synthesis routes below.

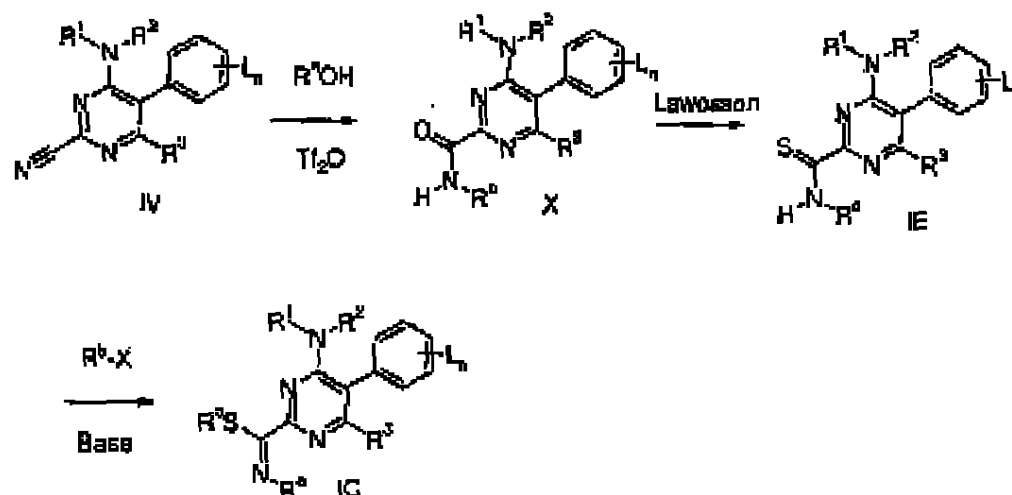
Scheme 5:



- As shown in Scheme 5, the nitriles IV described above can be reacted under acidic conditions with mercaptans R^bSH , where R^b is as defined above (see Chem. Ber. 113

(1980), 1898). In a subsequent reaction with azides, it is possible to introduce the radical R^4-N , where R^4 is as defined above (see Pol. J. Chem. 75 (2001), 975-82).

Scheme 6:



5

Scheme 6 shows an alternative synthesis route to the compounds IC according to the invention. Starting with the nitriles of the formula IV, the amides of the formula X are obtained in a modified Ritter reaction using alcohols of the formula R^4-OH and trifluoroacetic anhydride (see Tetrahedron Lett. 30 (1989), 581-82). The sulfurization with Lawesson's reagent can be carried out using the method described in J. Labelled Compd. Rad. 25 (1988), 335-343. The alkylation with R^5-X finally is carried out according to customary methods known from the literature, as described, for example, in Heterocycles 23 (1985), 2213-15.

15 What was said above refers in particular to the preparation of compounds in which R^3 is an alkyl group. If R^3 is a cyano group or an alkoxy substituent, the radical R^3 can be introduced by reaction with alkali metal cyanides and alkali metal alkoxides, respectively.

20 In the definitions of the symbols given in the formulae above, collective terms were used which are generally representative for the following substituents:

halogen: fluorine, chlorine, bromine and iodine;

25 alkyl: saturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 1 to 4, 6 or 8 carbon atoms, for example C_1-C_8 -alkyl such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 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,
30 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 and 1-ethyl-2-methylpropyl;

haloalkyl: straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 8 carbon atoms (as mentioned above), where in these groups some or all of the hydrogen atoms may be replaced by halogen atoms as mentioned above, for example C_1 - C_8 -haloalkyl, such as chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, pentafluoroethyl or 1,1,1-trifluoroprop-2-yl;

alkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 4 or 8 carbon atoms and a double bond in any position, for example C_2 - C_8 -alkenyl, such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methylethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl, 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;

alkadienyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 4, 6 or 8 carbon atoms and two double bonds in any position;

haloalkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 6 carbon atoms and a double bond in any position (as mentioned above), where in these groups some or all of the hydrogen atoms may be replaced by halogen atoms as mentioned above, in particular by fluorine, chlorine and bromine;

alkynyl: straight-chain or branched hydrocarbon groups having 2 to 6 carbon atoms and a triple bond in any position, for example C₂-C₆-alkynyl, such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butynyl, 2-butynyl, 3-butynyl, 1-methyl-2-propynyl, 1-pentynyl, 2-pentynyl, 3-pentynyl, 4-pentynyl, 1-methyl-2-butynyl, 1-methyl-3-butynyl, 2-methyl-3-butynyl, 3-methyl-1-butynyl, 1,1-dimethyl-2-propynyl, 1-ethyl-2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-methyl-2-pentynyl, 1-methyl-3-pentynyl, 1-methyl-4-pentynyl, 2-methyl-3-pentynyl, 2-methyl-4-pentynyl, 3-methyl-1-pentynyl, 3-methyl-4-pentynyl, 4-methyl-1-pentynyl, 4-methyl-2-pentynyl, 1,1-dimethyl-2-butynyl, 1,1-dimethyl-3-butynyl, 1,2-dimethyl-3-butynyl, 2,2-dimethyl-3-butynyl, 3,3-dimethyl-1-butynyl, 1-ethyl-2-butynyl, 1-ethyl-3-butynyl, 2-ethyl-3-butynyl and 1-ethyl-1-methyl-2-propynyl;

cycloalkyl: mono- or bicyclic saturated hydrocarbon groups having 3 to 6 carbon ring members, for example C₃-C₆-cycloalkyl such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl;

five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S:

- 5- or 6-membered heterocyclyl which contains one to three nitrogen atoms and/or one oxygen or sulfur atom or one or two oxygen and/or sulfur atoms, for example 2-tetrahydrofuryl, 3-tetrahydrofuryl, 2-tetrahydrothienyl, 3-tetrahydrothienyl, 2-pyrrolidinyl, 3-pyrrolidinyl, 3-isoxazolidinyl, 4-isoxazolidinyl, 5-isoxazolidinyl, 3-isothiazolidinyl, 4-isothiazolidinyl, 5-isothiazolidinyl, 3-pyrazolidinyl, 4-pyrazolidinyl, 5-pyrazolidinyl, 2-oxazolidinyl, 4-oxazolidinyl, 5-oxazolidinyl, 2-thiazolidinyl, 4-thiazolidinyl, 5-thiazolidinyl, 2-imidazolidinyl, 4-imidazolidinyl, 1,2,4-oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-triazolidin-3-yl, 1,3,4-oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-triazolidin-2-yl, 2,3-dihydrofur-2-yl, 2,3-dihydrofur-3-yl, 2,4-dihydrofur-2-yl, 2,4-dihydrofur-3-yl, 2,3-dihydrothien-2-yl, 2,3-dihydrothien-3-yl, 2,4-dihydrothien-2-yl, 2,4-dihydrothien-3-yl, 2-pyrrolin-2-yl, 2-pyrrolin-3-yl, 3-pyrrolin-2-yl, 3-pyrrolin-3-yl, 2-isoxazolin-3-yl, 3-isoxazolin-3-yl, 4-isoxazolin-3-yl, 2-isoxazolin-4-yl, 3-isoxazolin-4-yl, 4-isoxazolin-4-yl, 2-isoxazolin-5-yl, 3-isoxazolin-5-yl, 4-isoxazolin-5-yl, 2-isothiazolin-3-yl, 3-isothiazolin-3-yl, 4-isothiazolin-3-yl, 2-isothiazolin-4-yl, 3-isothiazolin-4-yl, 4-isothiazolin-4-yl, 2-isothiazolin-5-yl, 3-isothiazolin-5-yl, 4-isothiazolin-5-yl, 2,3-dihydropyrazol-1-yl, 2,3-dihydropyrazol-2-yl, 2,3-dihydropyrazol-3-yl, 2,3-dihydropyrazol-4-yl, 2,3-dihydropyrazol-5-yl, 3,4-dihydropyrazol-1-yl, 3,4-dihydropyrazol-3-yl, 3,4-dihydropyrazol-4-yl, 3,4-dihydropyrazol-5-yl, 4,5-dihydropyrazol-1-yl, 4,5-dihydropyrazol-3-yl, 4,5-dihydropyrazol-4-yl, 4,5-dihydropyrazol-5-yl, 2,3-

12

dihydrooxazol-2-yl, 2,3-dihydrooxazol-3-yl, 2,3-dihydrooxazol-4-yl, 2,3-dihydrooxazol-5-yl, 3,4-dihydrooxazol-2-yl, 3,4-dihydrooxazol-3-yl, 3,4-dihydrooxazol-4-yl, 3,4-dihydrooxazol-5-yl, 3,4-dihydrooxazol-2-yl, 3,4-dihydrooxazol-3-yl, 3,4-dihydrooxazol-4-yl, 2-piperidinyl, 3-piperidinyl, 4-piperidinyl, 1,3-dioxan-5-yl, 2-tetrahydropyranyl, 4-tetrahydropyranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-hexahydropyridazinyl, 4-hexahydropyridazinyl, 2-hexahydropyrimidinyl, 4-hexahydropyrimidinyl, 5-hexahydropyrimidinyl, 2-piperazinyl, 1,3,5-hexahydrotriazin-2-yl and 1,2,4-hexahydrotriazin-3-yl;

- 5-membered heteroaryl which contains one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; 5-membered heteroaryl groups which, in addition to carbon atoms, may contain one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom as ring members, for example 2-furyl, 3-furyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 3-isoxazolyl, 4-isoxazolyl, 5-isoxazolyl, 3-isothiazolyl, 4-isothiazolyl, 5-isothiazolyl, 3-pyrazolyl, 4-pyrazolyl, 5-pyrazolyl, 2-oxazolyl, 4-oxazolyl, 5-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-thiazolyl, 5-thiazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl, 1,2,4-oxadiazol-3-yl, 1,2,4-oxadiazol-5-yl, 1,2,4-thiadiazol-3-yl, 1,2,4-thiadiazol-5-yl, 1,2,4-triazol-3-yl, 1,3,4-oxadiazol-2-yl, 1,3,4-thiadiazol-2-yl and 1,3,4-triazol-2-yl;

- 6-membered heteroaryl which contains one to three or one to four nitrogen atoms; 6-membered heteroaryl groups which, in addition to carbon atoms, may contain one to three and one to four nitrogen atoms, respectively, as ring members, for example 2-pyridinyl, 3-pyridinyl, 4-pyridinyl, 3-pyridazinyl, 4-pyridazinyl, 2-pyrimidinyl, 4-pyrimidinyl, 5-pyrimidinyl, 2-pyrazinyl, 1,3,5-triazin-2-yl and 1,2,4-triazin-3-yl.

The scope of the present invention includes the (R) and (S) isomers and the racemates of compounds of the formula I having chiral centers.

Hereinbelow, the embodiments of the invention are described in more detail.

With a view to the intended use of the pyrimidines of the formula I, particular preference is given to the following meanings of the substituents, in each case on their own or in combination:

Preference is given to compounds I in which R^1 is C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl or C_3 - C_6 -cycloalkyl and R^2 is hydrogen.

Especially preferred are compounds I in which R^1 is C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl or C_1 - C_6 -haloalkyl branched in the α -position.

In addition, preference is given to compounds I in which R^1 is C_1 - C_4 -haloalkyl and R^2 is hydrogen.

- Moreover, preference is given to compounds I in which R^1 and R^2 together with the nitrogen to which they are attached form a five- or six-membered ring which may be interrupted by an oxygen atom and may carry one or two C_1 - C_3 -alkyl substituents.

Especially preferred are groups NR^1R^2 such as - in particular in the α -position - methylated pyrrolidines or piperidines. 4-Methylpiperidine is furthermore preferred.

- Moreover, particular preference is given to pyrimidines I in which the index n and the substituents L^1 to L^6 are as defined below:

- n is 1 to 3;
- L is halogen, cyano, C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_{10} -alkenyl, C_2 - C_{10} -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_{10} -alkenyloxy, C_2 - C_{10} -alkynyloxy, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A'')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$ or $S(=O)_2-A$;
- m is 0, 1 or 2;
- A, A', A'' independently of one another are hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, where the organic radicals may be partially or fully halogenated or may be substituted by cyano or C_1 - C_2 -alkoxy, or A and A' together with the atoms to which they are attached are a five- or six-membered saturated heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S.

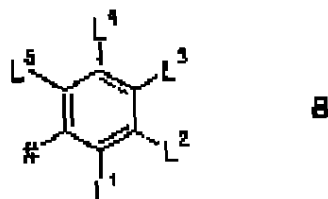
Especially preferred are pyrimidines I where the substituents L^1 to L^5 are as defined below:

- L is halogen, cyano, C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$,
- A, A', A'' independently of one another are hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl.

Particular preference is given to compounds I in which R'' is halogen, cyano, C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_{10} -alkenyl, C_2 - C_{10} -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_{10} -alkenyloxy, C_2 - C_{10} -alkynyloxy, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A'')(=N-OA)$, where the aliphatic or alicyclic groups for their part may be partially or fully halogenated.

Especially preferred are compounds I in which R^1 is halogen, cyano, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyloxy, C_2-C_6 -alkynyloxy.

- 5 Moreover, preference is given to pyrimidines I where the phenyl group substituted by L_n is the group B



where # is the point of attachment to the pyrimidine skeleton and

- 10 L^1 is fluorine, chlorine, CH_3 or CF_3 ;
 L^2, L^4 independently of one another are hydrogen, CH_3 or fluorine;
 L^3 is hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, cyano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $CO-NH_2$, $CO-NHCH_3$, $CO-NHC_2H_5$, $CO-N(CH_3)_2$, $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ or $COOCH_3$ and
 15 L^5 is hydrogen, fluorine, chlorine or CH_3 .

Particular preference is also given to compounds I in which R^3 is C_1-C_4 -alkyl which may be substituted by halogen.

- 20 Moreover, particular preference is given to compounds I in which R^3 is halogen, cyano, C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -alkoxy.

Especially preferred are compounds I in which R^3 is methyl, cyano, methoxy or in particular chlorine.

25

Suitable with a view to their fungicidal action are pyrimidines of the formula I in which R^4 is

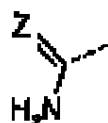


Preference is furthermore given to pyrimidines of the formula I in which R^4 is

15

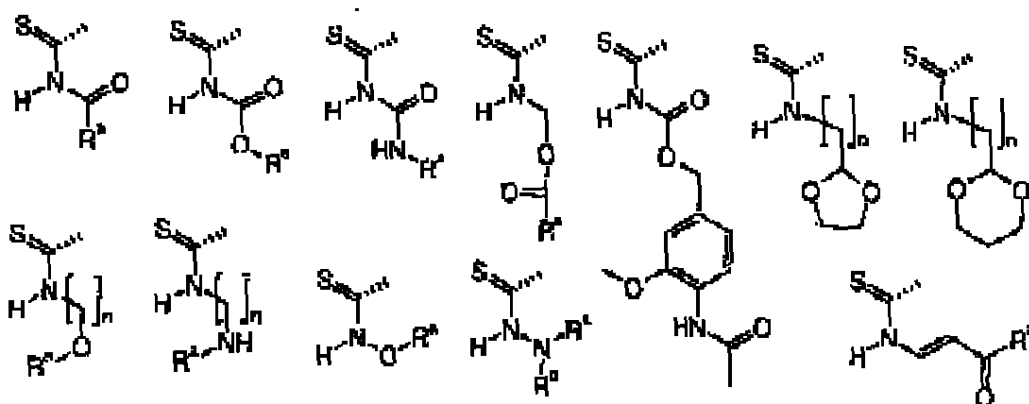


Especially preferred are pyrimidines of the formula I in which R¹ is



5

Finally, R^d may preferably have the following meanings, which may also be understood as prodrug radical definitions (see Medicinal Research Reviews 2003, 23, 763-793, or J. of Pharmaceutical Sciences 1997, 86, 765-767):

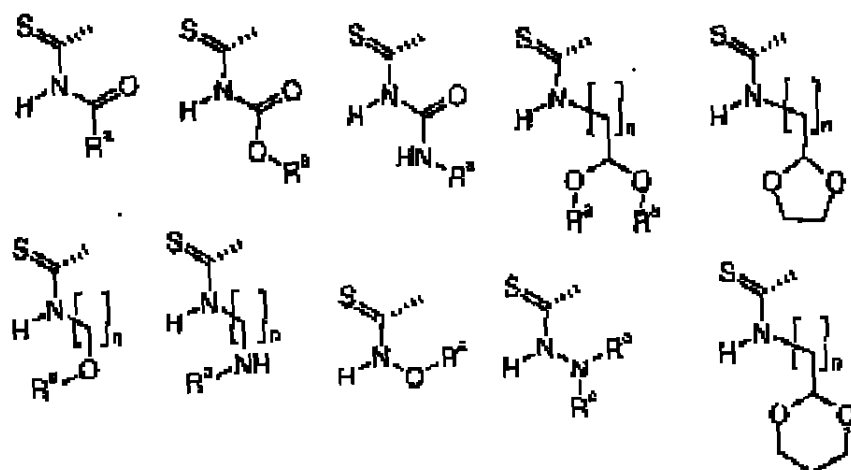


10

The index n in the alkenyl radicals of the above formulae is an integer from 1 to 3.

Particular preference is given to the radical definition R^4 :

16



The bridge member X is preferably a direct bond and $-(C=O)-$.

- 5 The substituent R^a is preferably hydrogen, methyl, allyl or propargyl and particularly preferably hydrogen.

The substituent R^b is preferably hydrogen, C_1-C_8 -alkyl or C_2-C_6 -alkenyl and with particular preference methyl, allyl or propargyl.

10

The substituent R^c is preferably hydrogen or methyl.

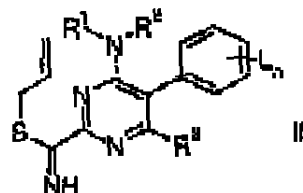
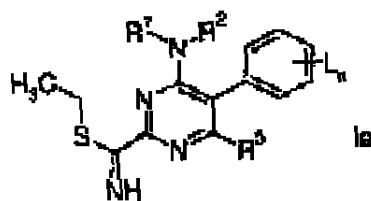
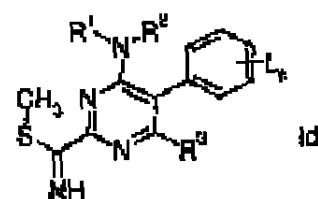
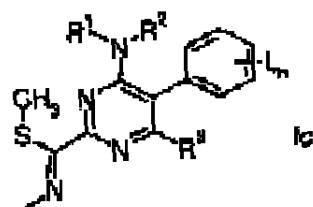
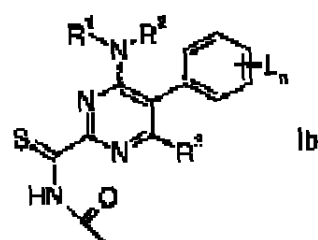
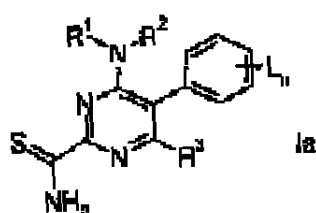


Table 1

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-chloro, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 2

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10 Table 3

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dichloro, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 4

15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-methyl, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 5

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trifluoro, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 6

25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-fluoro, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 7

30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxy-carbonyl, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 8

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-CN, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

35 Table 9

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,5-trifluoro, R^3 is methyl and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 10

18

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dichloro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 11

- 5 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 12

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 13

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-difluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 14

- 20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro, 4-chloro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 15

- 25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro, 4-fluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 16

- 30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3-difluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 17

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-difluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 18

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3,4-trifluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 19

- 45 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 20

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dimethyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 21

- 5 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-chloro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 22

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 23

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dimethyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 24

- Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trimethyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

20 Table 25

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-cyano, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 26

- 25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 27

- 30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxycarbonyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 28

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxy, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 29

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 30

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxycarbonyl, R^5 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 31

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-bromo, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10

Table 32

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-cyano, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

15

Table 33

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxy, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

20

Table 34

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,3-methyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25

Table 35

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

30

Table 36

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-cyano, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

35

Table 37

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-bromo, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

40

Table 38

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,5-fluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 39

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-methoxy, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 40

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl, 4-methoxycarbonyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10

Table 41

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl,4-bromo, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

15

Table 42

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-bromo, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 43

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxy, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 44

25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,5-methyl, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 45

30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is pentafluoro, R^3 is methyl and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 46

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluor,6-chloro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

35

Table 47

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 48

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dichloro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 49

- 5 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-methyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 50

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trifluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 51

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-fluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 52

- 20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxycarbonyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 53

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-CN, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25 Table 54

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,5-trifluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 55

- 30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dichloro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 56

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 57

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 58

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-difluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5 Table 59

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-chloro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 60

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-fluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 61

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3-difluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 62

- 20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-difluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 63

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3,4-trifluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25 Table 64

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 65

- 30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dimethyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 66

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-chloro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 67

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 68

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dimethyl, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5 Table 69

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trimethyl, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 70

10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-cyano, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 71

15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methyl, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 72

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxycarbonyl, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 73

25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxy, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 74

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methyl, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

30 Table 75

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxycarbonyl, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

35 Table 76

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-bromo, R^3 is chloro and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 77

25

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-cyano, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 78

- 5 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxy, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 79

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,3-methyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 80

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 81

- 20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-cyano, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 82

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-bromo, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 83

- 25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,5-fluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 84

- 30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-methoxy, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 85

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-methoxycarbonyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 86

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl,4-bromo, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 87

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-bromo, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5 Table 88

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxy, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 89

10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,5-methyl, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 90

15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is pentafluoro, R^3 is chloro and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 91

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-chloro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 92

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25 Table 93

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dichloro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 94

30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-methyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 95

35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trifluoro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 96

40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-fluoro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 97

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxy-carbonyl, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 98

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-CN, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10 Table 99

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,5-trifluoro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 100

15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dichloro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 101

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 102

25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 103

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-difluoro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

30 Table 104

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-chloro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 105

35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-fluoro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 106

40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3-difluoro, R^3 is methoxy and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 107

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-difluoro, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 108

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3,4-trifluoro, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

10

Table 109

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

Table 110

15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dimethyl, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

Table 111

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-chloro, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

Table 112

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methyl, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

25

Table 113

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dimethyl, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

30

Table 114

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If, in which L_n is 2,4,6-trimethyl, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

Table 115

35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-cyano, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

Table 116

40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methyl, R³ is methoxy and R¹, R² for each compound corresponds to one row of Table A

Table 117

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxycarbonyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of

5 Table A

Table 118

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxy, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10

Table 119

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

15 Table 120

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxycarbonyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

20 Table 121

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxy, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 122

25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-cyano, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 123

30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxy, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 124

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,3-methyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

35

Table 125

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

40 Table 126

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-cyano, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 127

- 5 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-bromo, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 128

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,5-fluoro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 129

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-methoxy, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 130

- 20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If, in which L_n is 2-methyl,4-methoxycarbonyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 131

- Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl,4-bromo, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25 Table 132

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-bromo, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 133

- 30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxy, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 134

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,5-methyl, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 135

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is pentafluoro, R^3 is methoxy and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 136

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-chloro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5 Table 137

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 138

- 10 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 139

- 15 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,6-methyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 140

- 20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trifluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 141

- Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-fluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25 Table 142

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxycarbonyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

30 Table 143

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-CN, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 144

- 35 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,5-trifluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 145

- 40 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dichloro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 146

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If, in which L_n is 2-chloro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 147

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10 Table 148

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-difluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 149

15 Table 149

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-chloro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 150

20 Table 150

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-fluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 151

25 Table 151

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3-difluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 152

30 Table 152

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-difluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

30 Table 153

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,3,4-trifluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 154

35 Table 154

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 155

40 Table 155

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4-dimethyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 156

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-chloro, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 157

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methyl, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10 Table 158

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-dimethyl, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 159

15 Table 159

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,4,6-trimethyl, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 160

20 Table 160

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-cyano, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 161

25 Table 161

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methyl, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 162

30 Table 162

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,6-difluoro,4-methoxycarbonyl, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 163

35 Table 163

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxy, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 164

Table 164

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methyl, R^3 is cyano and R^1 , R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 165

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-methoxycarbonyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 166

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-bromo, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10

Table 167

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-chloro,4-cyano, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

15

Table 168

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-difluoro,4-methoxy, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 169

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,3-methyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

20

Table 170

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

25

Table 171

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-cyano, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

30

Table 172

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-bromo, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

35

Table 173

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,5-fluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 174

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-methoxy, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

5

Table 175

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-methyl,4-methoxy-carbonyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

10

Table 176

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2,5-dimethyl,4-bromo, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

15

Table 177

Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-bromo, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 178

20 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,4-methoxy, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 179

25 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is 2-fluoro,5-methyl, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table 180

30 Compounds of the formulae Ia, Ib, Ic, Id, Ie and If in which L_n is pentafluoro, R^3 is cyano and R^1, R^2 for each compound corresponds to one row of Table A

Table A

No.	R^1	R^2
A-1.	CH_2CH_3	H
A-2.	CH_2CH_3	CH_3
A-3.	CH_2CH_3	CH_2CH_3
A-4.	$CH_2CH_2CH_3$	H
A-5.	$CH_2CH_2CH_3$	CH_3
A-6.	$CH_2CH_2CH_3$	CH_2CH_3
A-7.	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$

No.	R ¹	R ²
A-8.	CH ₂ CH ₂ F	H
A-9.	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃
A-10.	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₃
A-11.	CH ₂ CF ₃	H
A-12.	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-13.	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-14.	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15.	CH ₂ CCl ₃	H
A-16.	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-17.	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-18.	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-19.	CH(CH ₃) ₂	H
A-20.	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-21.	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-22.	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23.	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H
A-24.	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-25.	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-26.	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A-27.	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-28.	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29.	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-30.	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-31.	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-32.	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-33.	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-34.	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-35.	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-36.	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-37.	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-38.	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-39.	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-40.	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-41.	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-42.	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-43.	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-44.	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H

No.	R ¹	R ²
A-45.	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-46.	(S) CH(CH ₂)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-47.	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-48.	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-49.	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-50.	(R) CH(CH ₂)-C(CH ₃) ₃	H
A-51.	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-52.	(R) CH(CH ₂)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-53.	(S) CH(CH ₂)-C(CH ₃) ₃	H
A-54.	(S) CH(CH ₂)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-55.	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-56.	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-57.	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-58.	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-59.	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-60.	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-61.	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-62.	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-63.	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-64.	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65.	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-66.	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-67.	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-68.	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-69.	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-70.	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-71.	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-72.	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-73.	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-74.	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-75.	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-76.	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-77.	Cyclopentyl	H
A-78.	Cyclopentyl	CH ₃
A-79.	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-80.	Cyclohexyl	H
A-81.	Cyclohexyl	CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-82.	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-83.	-(CH ₂) ₆ -	
A-84.	(±) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-85.	(R) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-86.	(S) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-87.	-(CH ₂) ₂ -CH(OCH ₃)-CH ₂ -	
A-88.	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₂ CH ₃)-CH ₂ -	
A-89.	-(CH ₂) ₂ -CH[CH(CH ₃) ₂]-CH ₂ -	
A-90.	(±) -(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃)-	
A-91.	(±) -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-92.	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	
A-93.	-(CH ₂) ₅ -	
A-94.	(±) -(CH ₂) ₄ -CH(CH ₃)-	
A-95.	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-96.	(±) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-97.	(R) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-98.	(S) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-99.	-(CH ₂) ₂ -C(O[CH ₂] ₂ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-100.	$(\text{CH}_2)_2 \text{---} \triangle \text{---} \text{CH}_2$	
A-101.	-(CH ₂) ₂ -C(O[CH ₂] ₂ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-102.	-(CH ₂) ₂ -CH=CH-CH ₂ -	

The compounds I are suitable as fungicides. They are distinguished by an outstanding effectiveness against a broad spectrum of phytopathogenic fungi, especially from the classes of the Ascomycetes, Deuteromycetes, Oomycetes and Basidiomycetes. Some are systemically effective and they can be used in plant protection as foliar and soil fungicides.

They are particularly important in the control of a multitude of fungi on various cultivated plants, such as wheat, rye, barley, oats, rice, corn, grass, bananas, cotton, soybean, coffee, sugar cane, vines, fruits and ornamental plants, and vegetables, such as cucumbers, beans, tomatoes, potatoes and cucurbits, and on the seeds of these plants.

They are especially suitable for controlling the following plant diseases:

- *Alternaria* species on fruit and vegetables,
- *Bipolaris* and *Drechslera* species on cereals, rice and lawns.

- *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
 - *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamental plants and grapevines,
 - *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
 - 5 • *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
 - *Mycosphaerella* species on cereals, bananas and peanuts,
 - *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
 - *Plasmopara viticola* on grapevines,
 - *Podosphaera leucotricha* on apples,
 - 10 • *Pseudocercospora herpotrichoides* on wheat and barley,
 - *Pseudoperonospora* species on hops and cucumbers,
 - *Ruccinia* species on cereals,
 - *Pyricularia oryzae* on rice,
 - *Rhizoctonia* species on cotton, rice and lawns,
 - 15 • *Septoria tritici* and *Stagonospora nodorum* on wheat,
 - *Uncinula necator* on grapevines,
 - *Ustilago* species on cereals and sugar cane, and
 - *Venturia* species (scab) on apples and pears.
- 20 The compounds I are also suitable for controlling harmful fungi, such as *Paeuomyces varioti*, in the protection of materials (for example wood, paper, paint dispersions, fibers or fabrics) and in the protection of stored products.

- 25 The compounds I are employed by treating the fungi or the plants, seeds, materials or soil to be protected from fungal attack with a fungicidally effective amount of the active compounds. The application can be carried out both before and after the infection of the materials, plants or seeds by the fungi.

- 30 The fungicidal compositions generally comprise between 0.1 and 95%, preferably between 0.5 and 90%, by weight of active compound.

When employed in plant protection, the amounts applied are, depending on the kind of effect desired, between 0.01 and 2.0 kg of active compound per ha.

- 35 In seed treatment, amounts of active compound of 0.001 to 0.1 g, preferably 0.01 to 0.05 g, per kilogram of seed are generally necessary.

When used in the protection of materials or stored products, the amount of active compound applied depends on the kind of application area and on the desired effect.

Amounts customarily applied in the protection of materials are, for example, 0.001 g to 2 kg, preferably 0.005 g to 1 kg, of active compound per cubic meter of treated material.

The compounds I can be converted to the customary formulations, for example solutions, emulsions, suspensions, dusts, powders, pastes and granules. The application form depends on the particular intended use; it should in any case ensure a fine and uniform distribution of the compound according to the invention.

The formulations are prepared in a known manner, for example by extending the active compound with solvents and/or carriers, if desired using emulsifiers and dispersants. Solvents/auxiliaries which are suitable are essentially:

- water, aromatic solvents (for example Solvesso products, xylene), paraffins (for example mineral oil fractions), alcohols (for example methanol, butanol, pentanol, benzyl alcohol), ketones (for example cyclohexanone, gamma-butyrolactone), pyrrolidones (NMP, NOP), acetates (glycol diacetate), glycols, fatty acid dimethylamides, fatty acids and fatty acid esters. In principle, solvent mixtures may also be used.
- carriers such as ground natural minerals (for example kaolins, clays, talc, chalk) and ground synthetic minerals (for example highly disperse silica, silicates); emulsifiers such as nonionic and anionic emulsifiers (for example polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates and arylsulfonates) and dispersants such as lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

Suitable surfactants are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutyl-naphthalenesulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ethers, furthermore condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and formaldehyde, polyoxyethylene octylphenyl ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenyl polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether, trisearylphenyl polyglycol ether, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty alcohol/ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil, polyoxyethylene alkyl

ethers, ethoxylated polyoxypropylene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

- Substances which are suitable for the preparation of directly sprayable solutions, emulsions, pastes or oil dispersions are mineral oil fractions of medium to high boiling point, such as kerosene or diesel oil, furthermore coal tar oils and oils of vegetable or animal origin, aliphatic, cyclic and aromatic hydrocarbons, for example toluene, xylene, paraffin, tetrahydronaphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol, ethanol, propanol, butanol, cyclohexanol, cyclohexanone, isophorone, strongly polar solvents, for example dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone and water.

Powders, materials for spreading and dustable products can be prepared by mixing or concomitantly grinding the active substances with a solid carrier.

- Granules, for example coated granules, impregnated granules and homogeneous granules, can be prepared by binding the active compounds to solid carriers. Examples of solid carriers are mineral earths such as silica gels, silicates, talc, kaolin, attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate, magnesium sulfate, magnesium oxide, ground synthetic materials, fertilizers, such as, for example, ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, ureas, and products of vegetable origin, such as cereal meal, tree bark meal, wood meal and nut-shell meal, cellulose powders and other solid carriers.

- In general, the formulations comprise from 0.01 to 95% by weight, preferably from 0.1 to 90% by weight, of the active compounds. The active compounds are employed in a purity of from 90% to 100%, preferably 95% to 100% (according to NMR spectrum).

The following are examples of formulations: 1. Products for dilution with water

- A) Water-soluble concentrates (SL)

10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in water or in a water-soluble solvent. As an alternative, wetters or other auxiliaries are added. The active compound dissolves upon dilution with water.

- B) Dispersible concentrates (DC)

20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in cyclohexanone with addition of a dispersant, for example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion.

5 C) Emulsifiable concentrates (EC)

15 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5% strength). Dilution with water gives an emulsion.

10

D) Emulsions (EW, EO)

40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5% strength). This mixture is introduced into water by means of an emulsifier (Ultraturax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion.

15

E) Suspensions (SC, OD)

20

In an agitated ball mill, 20 parts by weight of a compound according to the invention are comminuted with addition of dispersants, wetters and water or an organic solvent to give a fine active compound suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound.

25

F) Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG, SG)

50 parts by weight of a compound according to the invention are ground finely with addition of dispersants and wetters and made into water-dispersible or water-soluble granules by means of technical appliances (for example extrusion, spray tower, fluidized bed). Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound.

30

G) Water-dispersible powders and water-soluble powders (WP, SP)

35

75 parts by weight of a compound according to the invention are ground in a rotor-stator mill with addition of dispersants, wetters and silica gel. Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound.

40 2. Products to be applied undiluted

H) Dusts (DP)

5 parts by weight of a compound according to the invention are ground finely and mixed intimately with 95% of finely divided kaolin. This gives a dustable product.

5

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

0.5 part by weight of a compound according to the invention is ground finely and associated with 95.5% carriers. Customary methods are extrusion, spray-drying or the fluidized bed. This gives granules to be applied undiluted.

10

J) ULV solutions (UL)

10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in an organic solvent, for example xylene. This gives a product to be applied undiluted.

15

The active compounds can be used as such, in the form of their formulations or of the application forms prepared therefrom, e.g. in the form of directly sprayable solutions, powders, suspensions or dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dustable products, preparations for broadcasting or granules, by spraying, atomizing, dusting, broadcasting or watering. The application forms depend entirely on the intended uses; they should always ensure the finest possible dispersion of the active compounds according to the invention.

20

Aqueous application forms can be prepared from emulsifiable concentrates, pastes or wettable powders (spray powders, oil dispersions) by addition of water. To prepare emulsions, pastes or oil dispersions, the substances can be homogenized in water, as such or dissolved in an oil or solvent, by means of wetting agents, tackifiers, dispersants or emulsifiers. However, it is also possible to prepare concentrates comprising active substance, wetting agent, tackifier, dispersant or emulsifier and possibly solvent or oil which are suitable for dilution with water.

25

30

The concentrations of active compound in the ready-for-use preparations can be varied within relatively wide ranges. In general, they are between 0.0001 and 10%, preferably between 0.01 and 1%.

35

The active compounds can also be used with great success in the ultra-low volume (ULV) process, it being possible to apply formulations with more than 95% by weight of active compound or even the active compound without additives.

Oils of various types, wetting agents, adjuvants, herbicides, fungicides, other pesticides and bactericides can be added to the active compounds, if need be also not until immediately before use (tank mix). These agents can be added to the preparations according to the invention in a weight ratio of 1:10 to 10:1.

The preparations according to the invention can, in the application form as fungicides, also be present together with other active compounds, e.g. with herbicides, insecticides, growth regulators, fungicides or also with fertilizers. On mixing the compounds or the preparations comprising them in the application form as fungicides with other fungicides, in many cases an expansion of the fungicidal spectrum of activity is obtained.

The following list of fungicides, with which the compounds according to the invention can be used in conjunction, is intended to illustrate the possible combinations but does not limit them:

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,
- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamine or tridemorph,
- anilinopyrimidine, such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyprodinyl,
- antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,
- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizole or triticonazole,
- dicarboximides, such as iprodione, myclozolin, procymidone or vinclozolin,
- dithiocarbamates, such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram or zineb,

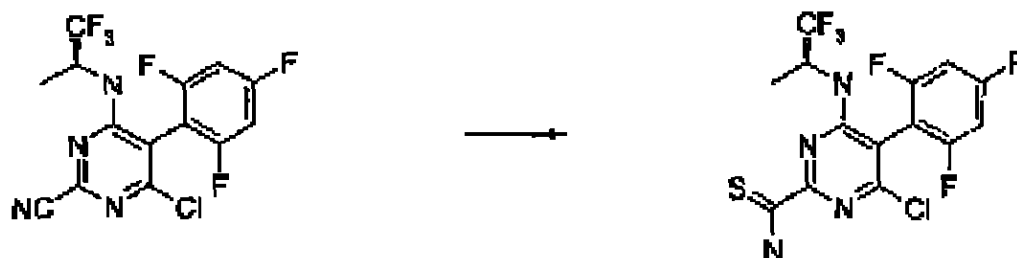
45

- heterocyclic compounds, such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenoxy, pyroquilon, quinoxifen, siltiofam, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, thiadiazole, tricyclazole or triforine,
5
- copper fungicides, such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride or basic copper sulfate,
- 10 • nitrophenyl derivatives, such as binapacryl, dinocap, dinobuton or nitrophthal-isopropyl,
- phenylpyrroles, such as fenpiclonil or fludioxonil,
- 15 • sulfur,
- other fungicides, such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, diclomezine, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fenlin acetate, fenoxanil,
20 ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenone, penicuron, propamocarb, phthalide, tolclofos-methyl, quintozene or zoxamide,
- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
25
- sulfenic acid derivatives, such as captan, dichlofluanid, folpet or tolylfluanid,
- 30 • cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

Synthesis examples

- 35 Example 1: Synthesis of (S)-4-chloro-6-(2,2,2-trifluoro-1-methylethylamino)-5-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrimidine-2-thiocarbamide

46



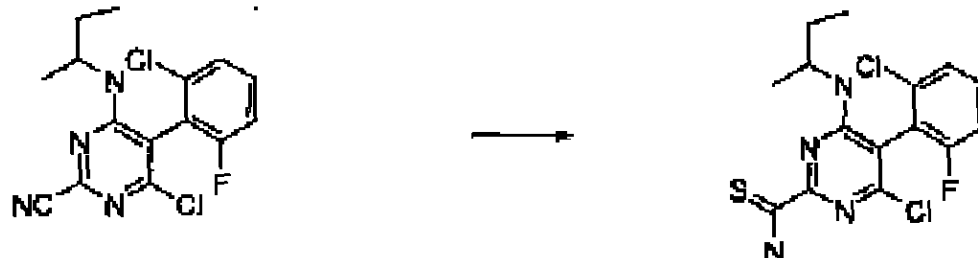
At room temperature, hydrogen sulfide was introduced for 5 minutes into a solution of 0.5 g (1.35 mmol) of (S)-4-chloro-6-(2,2,2-trifluoro-1-methylethylamino)-5-(2,4,6-trifluorophenyl)pyrimidine-2-carbonitrile, prepared according to WO 03/043993, in

5 0.16 g of triethylamine and 8 ml of N-methylpyrrolidone. After the reaction had ended, 20 ml of water were added, the mixture was neutralized with acetic acid and extracted with methyl tert-butyl ether and the organic phase was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated.

Yield: 0.44 g (81% of theory)

10 M.p.: 101-103°C

Example 2: Synthesis of 4-sec-butylamino-6-chloro-5-(2-chloro-6-fluorophenyl)-pyrimidine-2-thiocarbamide



15 At room temperature, hydrogen sulfide was introduced for 5 minutes into a solution of 1.0 g (2.9 mmol) of 4-sec-butylamino-6-chloro-5-(2-chloro-6-fluorophenyl)pyrimidine-2-carbonitrile in 0.36 g of triethylamine and 12 ml of N-methylpyrrolidone. After the reaction had ended, 20 ml of water were added, the mixture was neutralized with acetic acid and extracted with methyl tert-butyl ether and the organic phase was washed with

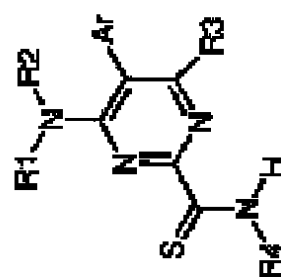
20 water, dried over magnesium sulfate and concentrated.

Yield: 0.57 g (53% of theory)

M.p.: 147-150°C

The compounds listed in the table below were synthesized analogously to the procedures given above.

25



No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Ar	m.p.: [°C]	¹ H-NMR [ppm, CHCl ₃]
I-1	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)	CH ₂ CH ₂	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl	170-172	
I-2	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	101-103	
I-3	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl		1.21 (d, 6H); 4.42 (m, br, 2H); 7.21 (t, 1H); 7.36 (m, 2H); 8.03 (s, br, 1H); 9.12 (s, br, 1H)
I-4	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	145-149	
I-5	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	110-113	

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A ¹	M.P.: [°C]	¹ H-NMR [ppm, CHCl ₃]
I-6	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH		Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl		1.27 (d, 3H); 1.6 (m, 4H); 3.82 (m, 2H); 4.48 (m, 1H); 8.76 (m, 2H); 7.80 (s, br, 1H); 9.04 (s, br, 1H)
I-7	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	130-132	
I-8	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl	147-150	
I-9	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl		1.03 (m, 3H); 1.45 (s, 3H); 3.24 (m, 1H); 3.50 (m, 1H); 3.83 (m, 2H); 4.79 (s, 2H); 7.10 (m, 1H); 7.36 (m, 2H); 8.00 (s, br, 1H); 9.05 (s, br, 1H)
I-10	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl		0.88 (dd, 6H); 1.20 (dd, 3H); 1.79 (m, 1H); 4.45 (m, br, 2H); 7.20 (m, 1H); 7.43 (m, 2H); 7.70 (s, br, 1H); 9.06 (s, br, 1H)
I-11	(S)-	H	Cl	H	2-chloro-4-		0.85 (dd, 6H); 1.15 (dd, 3H);

No.	R'	R ²	R ¹	Ar	m.p.: [°C]	¹ H-NMR [ppm, CHCl ₃]
	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂			fluorophenyl		1.75 (m, 1H); 4.40 (m, br, 2H); 7.19 (m, 1H); 7.33 (m, 2H); 8.03 (s, br, 1H); 9.11 (s, br, 1H)
I-12	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂			2,4- difluorophen- yl		0.84 (dd, 6H); 1.16 (dd, 3H); 1.78 (m, 1H); 4.30 (m, br, 2H); 7.00 (m, 1H); 7.06 (m, 1H); 7.38 (m, 1H); 8.0 (s, br, 1H); 9.0 (s, br, 1H)
I-13	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	2,4,6- trifluoro- phenyl	54-60	
I-14	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	Cl	H	2-chloro-6- fluorophenyl	120-123	
I-15	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	Cl	H	2,4,6- trifluoro- phenyl	142-145	
I-16	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)C H ₂ CH ₂	Cl	H	2,4,6- trifluorophenyl	66-69	
I-17	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	Cl	COCH ₃	2,4,6- trifluoro- phenyl	55-58	

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Ar	m.p.: [°C]	¹ H-NMR [ppm, CHCl ₃]
I-18	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	Cl	H	2-chloro-4-fluorophenyl		1.34 (m, 3H); 4.4 (d, 1H); 4.94 (m, 1H); 7.19 (m, 1H); 7.31 (m, 2H); 8.31 (s, 1H); 8.92 (s, 1H); 11.61 (s, 1H)
I-19	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	55-58	1.03 (m, 6H); 3.37 (m, 4H); 6.8 (m, 2H); 8.03 (m, 1H); 9.02 (m, 1H)
I-20	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-chloro-4-fluorophenyl		0.85 (m, 6H); 1.1 (m, 3H); 1.7 (m, 1H); 4.03 (s, 1H); 4.35 (d, 1H); 7.17 (m, 1H); 7.33 (m, 2H); 7.7 (s, 1H); 8.86 (s, 1H); 11.39 (s, 1H)
I-21	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	COCH ₃	2,4,6-trifluorophenyl		1.07 (m, 6H); 2.65 (s, 3H); 3.37 (m, 4H); 6.83 (t, 2H); 11.62 (s, 1H)
I-22	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	2-chloro-4-fluorophenyl	172-175	
I-23	CH(CH ₃) ₂	H	Me	H	2,4,6-trifluorophenyl	158	
I-24	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Me	H	2,4,6-	114-117	

No.	R ¹	R ²	R ³	Ar	m.p.: [°C]	¹ H-NMR [ppm, CHCl ₃]
				trifluoro- phenyl		
1-25	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)C H ₂ CH ₂	Me	H	2,4,6- trifluoro- phenyl	149-151	

Examples of the action against harmful fungi

5 The fungicidal action of the compounds of the formula I was demonstrated by the following experiments:

10 The active compounds were prepared separately as a stock solution with 0.25% by weight of active compound in acetone or DMSO. 1% by weight of the emulsifier Uniperol® EL (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkyl-phenols) was added to this solution. The stock solutions of the active compounds were diluted with water to the desired concentration.

Use examples

- 15 1) Activity against gray mold on bell pepper leaves caused by *Botrytis cinerea*, protective application

20 Bell pepper seedlings of the cultivar "Neusiedler Ideal Elite" were, after 4 - 5 leaves were well developed, sprayed to runoff point with an aqueous suspension having a concentration of active compound of 250 ppm. The next day, the treated plants were inoculated with a spore suspension of *Botrytis cinerea*, this contained 1.7×10^6 spores/ml in a 2% strength aqueous biomalt solution. The test plants were then placed in a climate-chamber at 22-24°C and high atmospheric humidity. After 5 days, the extent of the fungal infection on the leaves was determined visually in %.

25 In this test, the plants which had been treated with compounds I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-10 and I-11 were not infected, whereas the untreated plants were 90% infected.

- 30 2) Activity against mildew on cucumber leaves caused by *Sphaerotheca fuliginea*, protective application

35 The leaves of potted cucumber seedlings of the cultivar "Chinese snake" were, at the cotyledon stage, sprayed to runoff point with an aqueous suspension having a concentration of active compound of 250 ppm. 20 hours after the spray coating had dried, the plants were inoculated with an aqueous spore suspension of mildew of cucumber (*Sphaerotheca fuliginea*). The plants were then cultivated in a greenhouse at 20-24°C and 60-80% relative atmospheric humidity for 7 days. The extent of the mildew development was then determined visually in % infection of the cotyledon area.

In this test, the plants which had been treated with compounds I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10 and I-11 showed no infection or infection of less than 10%, whereas the untreated plants were 100% infected.

5 3) Activity against early blight of tomatoes caused by *Alternaria solani*

Leaves of potted plants of the cultivar "Goldene Prinzessin" were sprayed to runoff point with an aqueous suspension having an active compound concentration of 250 ppm. The next day, the leaves were infected with an aqueous spore suspension of *Alternaria solani* in a 2% biomalt solution having a density of 0.17×10^8 spores/ml. The plants were then placed in a water-vapor-saturated chamber at 20 - 22°C. After 5 days, the early blight on the untreated, but infected control plants had developed to such an extent that the infection could be determined visually in %.

15 In this test, the plants which had been treated with compounds I-13, I-14, I-15, I-16, I-17 and I-19 had an infection of <5%, while the untreated plants were 80% infected.

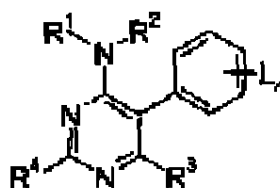
4) Activity against net blotch of barley caused by *Pyrenophora teres*

20 Leaves of pot-grown barley seedlings of the cultivar "Hanna" were sprayed to runoff point with an aqueous suspension having an active compound concentration of 250 ppm. 24 hours after the spray coating had dried on, the test plants were inoculated with an aqueous suspension of spores of *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *teres*, the causative agent of net blotch. The test plants were subsequently placed in a
25 greenhouse at temperatures of between 20 and 24°C and a relative atmospheric humidity of 95 to 100%. After 6 days, the extent of development of the disease was determined visually in % of infection of the total leaf area.

In this test, the plants treated with compounds I-13, I-14, I-15, I-16, I-17 and I-19 had an
30 infection of 10%, while the untreated plants were 80% infected.

We claim:

1. A 2-substituted pyrimidine of the formula I



I

in which the index and the substituents are as defined below:

n is an integer from 1 to 5;

L is halogen, cyano, cyanato (OCN), C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₈-alkoxy, C₂-C₈-alkenyloxy, C₂-C₈-alkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkyl, C₄-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₄-C₆-cycloalkenyloxy, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A or S(=O)_m-N(A')A,

m is 0, 1 or 2;

A, A', A'' independently of one another are hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, phenyl, where the organic radicals may be partially or fully halogenated or may be substituted by nitro, cyanato, cyano or C₁-C₄-alkoxy; or A and A' together with the atoms to which they are attached are a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S;

where the aliphatic groups of the radical definitions of L for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to four groups R^u:

R^u is cyano, C₁-C₈-alkoxy, C₃-C₆-cycloalkyl, C₂-C₈-alkenyloxy, C₂-C₈-alkynyloxy, C₄-C₆-cycloalkenyl, C₂-C₆-cycloalkyloxy, C₄-C₆-cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A or S(=O)_m-N(A')A;

R^1, R^2 independently of one another are C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_3-C_6 -halocycloalkyl, where the aliphatic groups of the radical definitions of R^1 and R^2 may for their part be partially or fully halogenated or may carry one to four groups R^3 :

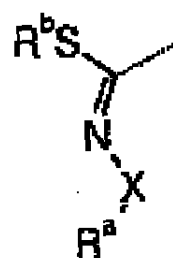
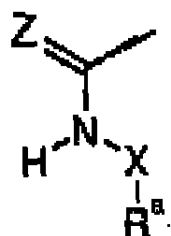
R^3 is cyano, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_4-C_6 -cycloalkenyl, hydroxyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyloxy, C_2-C_6 -alkynyloxy, C_3-C_6 -cycloalkyloxy, C_4-C_6 -cycloalkenyloxy, C_4-C_6 -alkylthio, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A') (=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ or $S(=O)_m-N(A')A$ or phenyl, where the phenyl moiety may carry one to three radicals selected from the group consisting of halogen, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -halogenalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, cyano, nitro, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A') (=N-OA)$, $N(A')A$;

R^2 may additionally be hydrogen;

R^1 and R^2 may also, together with the nitrogen atom to which they are attached, form a saturated or unsaturated five- or six-membered ring which may be interrupted by an ether ($-O-$), carbonyl ($C=O$), thio ($-S-$), sulfoxyl ($-S(=O)-$) or sulfenyl ($-SO_2-$) or a further amino ($-N(R^2)$) group where R^2 is hydrogen or C_1-C_6 alkyl and/or may contain one or more substituents from the group consisting of halogen, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -haloalkyl and oxy- C_1-C_3 -alkylenoxy;

R^3 is halogen, cyano, C_1-C_4 -alkyl, C_2-C_4 -alkenyl, C_2-C_4 -alkynyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyloxy, C_2-C_6 -alkynyloxy, C_1-C_6 -alkylthio, di- $(C_1-C_6$ -alkyl)amino or C_1-C_6 -alkylamino, where the alkyl, alkenyl and alkynyl radicals of R^3 may be substituted by halogen, cyano, nitro, C_1-C_2 -alkoxy or C_1-C_4 -alkoxycarbonyl;

R^4 corresponds to one of the formulae



where

x is a direct bond, $-(C=O)-$, $-(C=O)-NH-$, $-(C=O)-O-$, $-O-$, $-NR^c$, where the molecule moiety to the left in each case is attached to the nitrogen atom;

5

R^a is hydrogen, methyl, benzyl, trifluoromethyl, allyl, propargyl or methoxymethyl;

R^b is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl;

10

R^c is hydrogen, methyl or C_1-C_4 -acyl and

Z is S or NR^d ;

15

where the aliphatic groups of the radical definitions of R^a , R^b and/or R^c for their part may carry one or two groups R'' :

R'' is halogen, OR^e , NHR^e , C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxycarbonyl, C_1-C_4 -acylamino, [1,3]dioxolane- C_1-C_4 -alkyl, [1,3]dioxane- C_1-C_4 -alkyl, where

20

[R^e is hydrogen, methyl, allyl or propargyl.

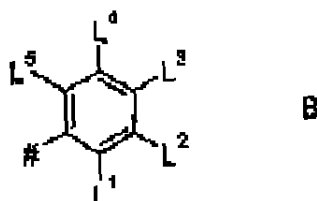
2. A 2-substituted pyrimidine as claimed in claim 1, where R^a is chlorine, cyano, methyl or methoxy.

25

3. A 2-substituted pyrimidine as claimed in claim 1, where R^a is hydrogen and R^b is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl or C_2-C_6 -alkenyl.

4. A 2-substituted pyrimidine as claimed in any of claims 1 to 3, in which the phenyl group substituted by L_n is the group B

30



where # is the point of attachment to the pyrimidine skeleton and

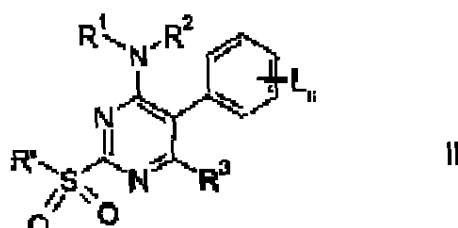
L^1 is fluorine, chlorine, CH_3 or CF_3 ;

35

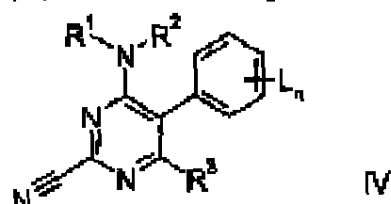
L^2 , L^4 independently of one another are hydrogen, CH_3 or fluorine;

- L^3 is hydrogen, fluorine, chlorine, cyano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ or $COOCH_3$ and
 L^5 is hydrogen, fluorine, chlorine or CH_3 .

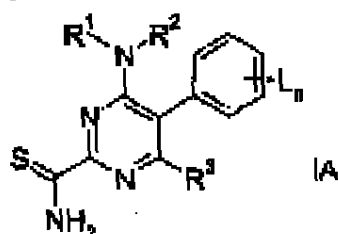
5. A process for preparing 2-substituted pyrimidines of the formula I as claimed in claim 1, where R^4 is a thioamide, which comprises reacting a compound of the formula II



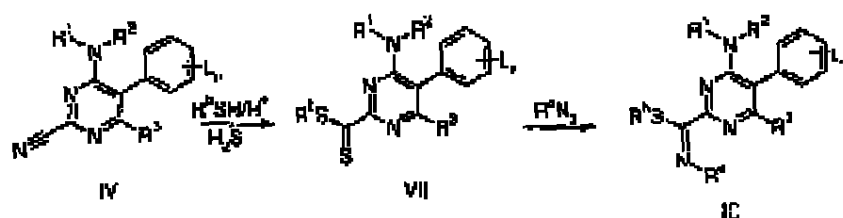
- 10 in which the substituents L , R^1 , R^2 and R^3 are as defined in claim 1 and R^4 is an unsubstituted or substituted C_1-C_6 -alkyl radical or an unsubstituted or substituted phenyl radical with an alkali metal cyanide, alkaline earth metal cyanide or lithium cyanide of the formula (III) and then reacting the resulting compound IV



- 15 with hydrogen sulfide to give IA



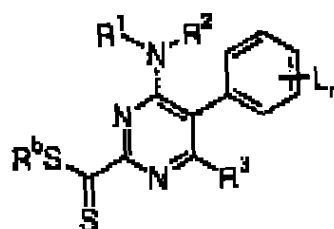
6. A process for preparing compounds of the formula IC, where the substituents L^{11} , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as defined in claim 1



58

starting from nitrile IV by reaction with mercaptans of the formula R^3SH under acidic conditions and further reaction of the dithiocarboxylic ester of the formula VII which is obtained, with azides of the formula R^4N_3 .

- 6 7. A compound of the formula VII



VII

where the substituents R^1 , R^2 , R^3 , R^b and L_n have the meaning in claim 1.

10

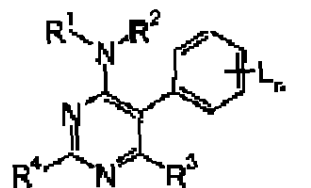
8. A composition suitable for controlling harmful fungi, which composition comprises a solid or liquid carrier and a compound of the formula I as claimed in claim 1.
9. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or the seeds to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I as claimed in claim 1.

15

2-Substituted pyrimidines

Abstract

5 The invention relates to 2-substituted pyrimidines of the formula I



in which the index n and these substituents R^1 , R^2 and R^3 are as defined in the description and R^4 is as defined below:

10 R^4 corresponds to one of the formulae



where

15 R^5 is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_{11} -alkenyl, C_2-C_2 -alkynyl, C_3-C_6 -cycloalkyl or C_1-C_4 -alkoxy and

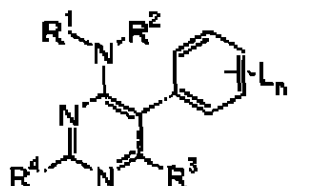
R^6 is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_{11} -alkynyl, C_1-C_4 -alkyloxy- C_1-C_2 -alkyl, phenyl- C_1-C_2 -alkyl or phenyloxy- C_1-C_2 -alkyl,

20 to processes for preparing these compounds, to compositions comprising these compounds and to their use as pesticides.

Pirimidinas 2-sustituídas

Descripción

5 La presente invención se refiere a pirimidinas 2-sustituídas de la fórmula I,



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

10 n es un número entero de 1 a 5;

L significa halógeno, ciano, cianato (OCN), -alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₁₁,
 alquinilo C₂-C₈, alcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₁₁, alquinilo C₂-C₈,
 cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₄-C₆, cicloalquiloxi C₃-C₆, cicloalquenilo C₄-C₆,
 15 C₄-C₆, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A'')(=N-OA), N(A')A,
 N(A'')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-
 N(A')A,

m 0, 1 ó 2;

20

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆,
 alquenilo C₂-C₁₁, alquinilo C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₄-
 C₆, fenilo, cuyos radicales orgánicos pueden estar parcial o

completamente halogenados o sustituidos por nitro, cianato, ciano o C₁-C₄-alcoxi; o A y A' pueden formar junto con los átomos a los que están ligados un heterociclo de cinco a seis miembros saturado, no saturado o aromático, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S;

puediendo los grupos alifáticos de las demás definiciones de L estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R¹:

10 R¹ significa ciano, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, cicloalqueno C₃-C₈, cicloalquiloxi C₃-C₈, cicloalquenilo C₄-C₈, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A;

15 R¹, R² significan, independientemente, alquilo C₁-C₈, alqueno C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, halógenocicloalquilo C₃-C₈, pudiendo los grupos alifáticos de las definiciones de los radicales R¹ y R² a su parte estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R¹:

20 R² ciano, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₄-C₈, hidroxilo, alcoxi C₁-C₈, alqueno C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, cicloalquiloxi C₃-C₈, cicloalquenilo C₄-C₈, alquiloxi C₃-C₈, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A o fenilo, pudiendo la parte de fenilo llevar uno a tres radica-

25

les seleccionados del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, ciano, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A;

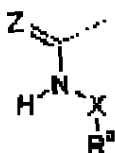
5 R² puede significar adicionalmente hidrógeno;

R¹ y R² pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter-(O-), carbonilo -(C=O), tio -(S-),
 10 sulfoxilo -(S(=O)-) o sulfenilo -(SO₂-) o un grupo amino -(N(R³)) adicional, donde R³ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆, y/o contener uno o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆ y oxialquilenoxi C₁-C₃;

15 R³ es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₄, alquiniloxi C₃-C₄, alquiltio C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)amino o alquilamino C₁-C₆, pudiendo los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo de R³ estar sustituidos por halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₂ o alcoxicarbonilo C₁-C₄;

20

R⁴ corresponde a una de las fórmulas



en donde

- X es un enlace directo, $-(C=O)$, $-(C=O)-NH$, $-(C=O)-O$, $-O$, $-NR^c$,
estando cada vez la parte izquierda de la molécula ligada con el átomo de nitrógeno;
- 5 R^a es hidrógeno, metilo, bencilo, tritluorometilo, alilo, propargilo o metoximetilo;
- R^b es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquínilo C_2-C_8 ;
- 10 R^c es hidrógeno, metilo o acilo C_1-C_4 ;
- Z significa S o NR^d ;
- 15 pudiendo los grupos alifáticos de las definiciones de los radicales R^a , R^b y/o R^c a su vez llevar uno o dos grupos R^d ;
- R^d significa halógeno, OR^a , NHR^a , alquilo C_1-C_6 , alcóxicarbonilo C_1-C_4 ,
acilamino C_1-C_4 , [1,3]dioxolano -alquilo- C_1-C_4 , [1,3]dioxano -alquilo-
20 C_1-C_4 , significando
- R^a hidrógeno, metilo, alilo o propargilo.

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

- 5 De la WO-A 01/96314 se conocen pirimidinas fungicidas, que en la posición 2 llevan un sustituyente. Además, se conocen de la WO-A 03/43993 pirimidinas fungicidas, que en la posición 2 llevan, por ejemplo, un radical amido.

10 Pero la acción de las pirimidinas arriba mencionadas no es satisfactoria en muchos casos. Por tanto, la presente invención tuvo por objeto hallar compuestos con eficiencia mejorada.

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

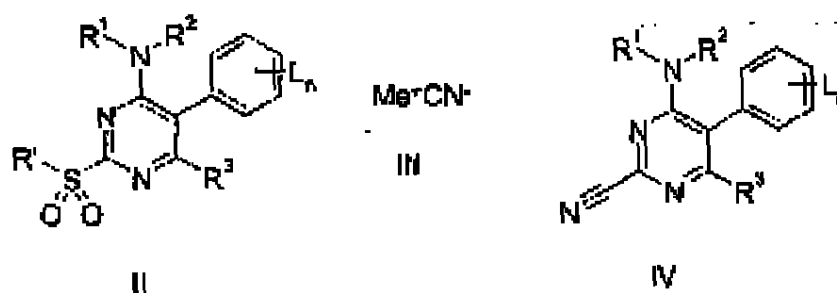
Los compuestos I pueden ser preparados mediante diferentes métodos.

20 Por ejemplo, se puede partir de sulfonas de la fórmula II, cuya obtención se describe en detalle en la WO-A 02/074753 o la DE 10156279.9 y donde R' significa un radical alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, eventualmente sustituido o un radical fenilo eventualmente sustituido. Transformando las sulfonas II con cianuros metálicos III (Me⁺CN⁻) se generan los nitrilos IV. Bajo cianuros de metal se entienden en primera línea los cianuros alcalinos o alcalinotérreos o también cianuros covalentes, como p.ej. cianuro

25 de estaño

PF 54728

6

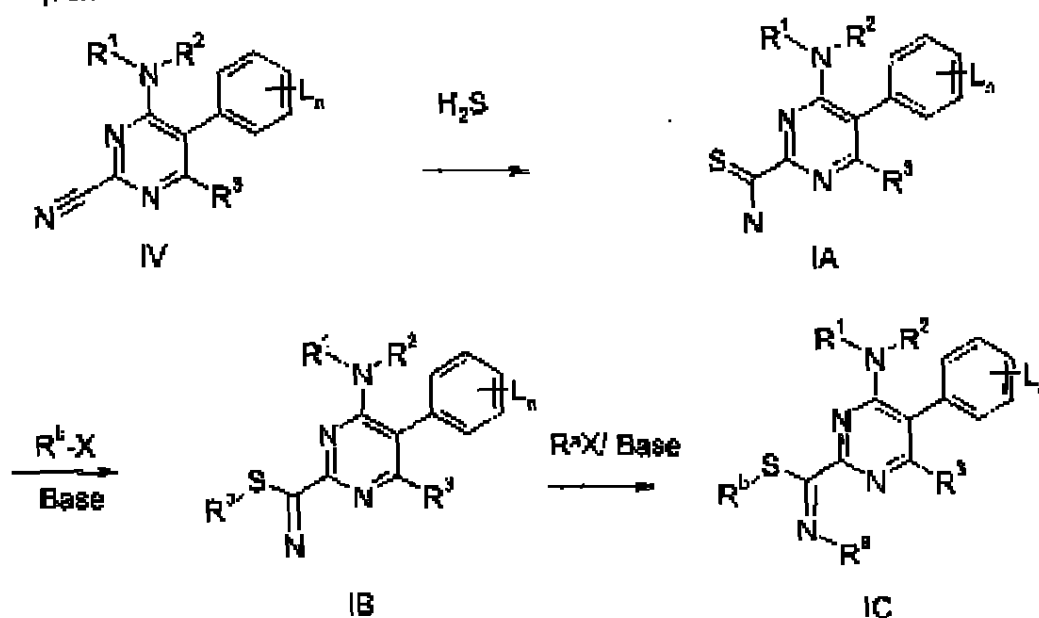


El intercambio del grupo sulfona por el grupo nitrilo se efectúa mediante los métodos conocidos de la literatura, como por ejemplo, aquellos descritos en la WO-A 03/043993.

5

La síntesis ulterior puede efectuarse a como está representado en el esquema 1:

Esquema 1:



- 10 El compuesto nitrilo IV puede ser hidrolizado con sulfuro de hidrógeno bajo condiciones preferentemente ácidas, dando la tiamida IA. La tiólisis se efectúa bajo las condiciones de la reacción de Pinner (ver Ejemplos de obtención). La alquilación con R^b-X, teniendo R^b los significados arriba indicados y representando X un grupo disociable, como p.ej. un haluro, sulfato o sulfonato, proporciona compuesto de tipo IB. Una segun-

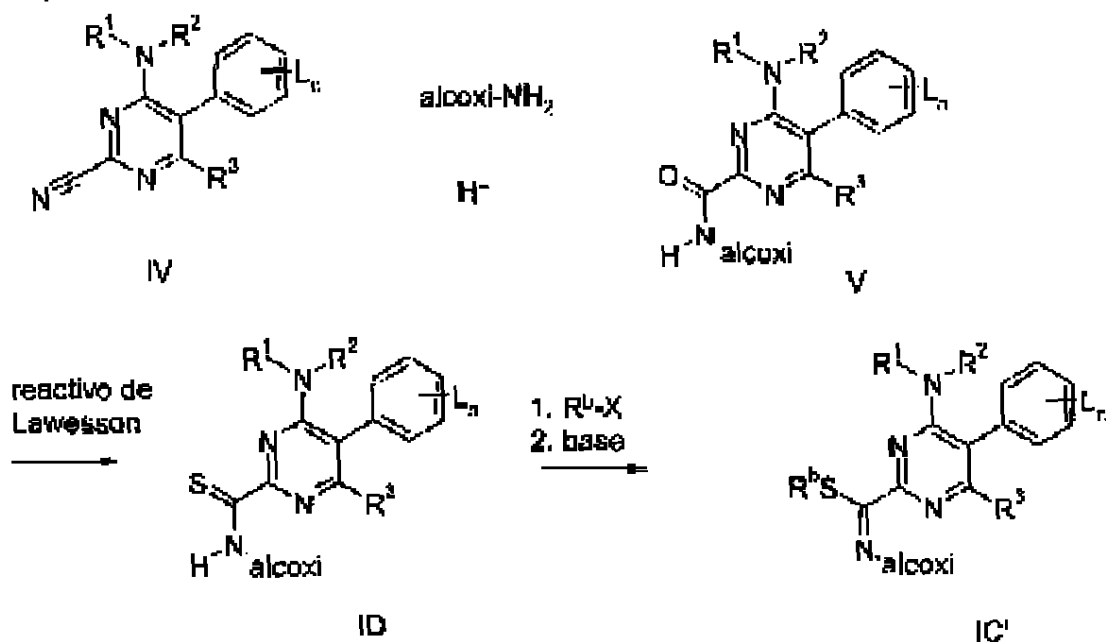
da etapa de alquilación con R^b-X , donde R^b significa, por ejemplo, alquilo C_1-C_6 y X representa un grupo dissociable, tal como haluro, sulfato o sulfonato, proporciona compuesto de tipo IC. Las dos alquilaciones arriba mencionadas pueden ser realizadas también con sales de Meerwein de la fórmula: $(R^3)_3OBF_4$, en analogía a las prescrip-

5 ciones indicadas en Synth. Commun., 1983, 13, S. 753 o Helv. Chim. Acta, 1986, 69, p. 1224.

Los compuesto según la invención IC', donde R^a significa un sustituyente alcoxi C_1-C_6 , se pueden preparar en la forma representada en el esquema 2.

10

Esquema 2:



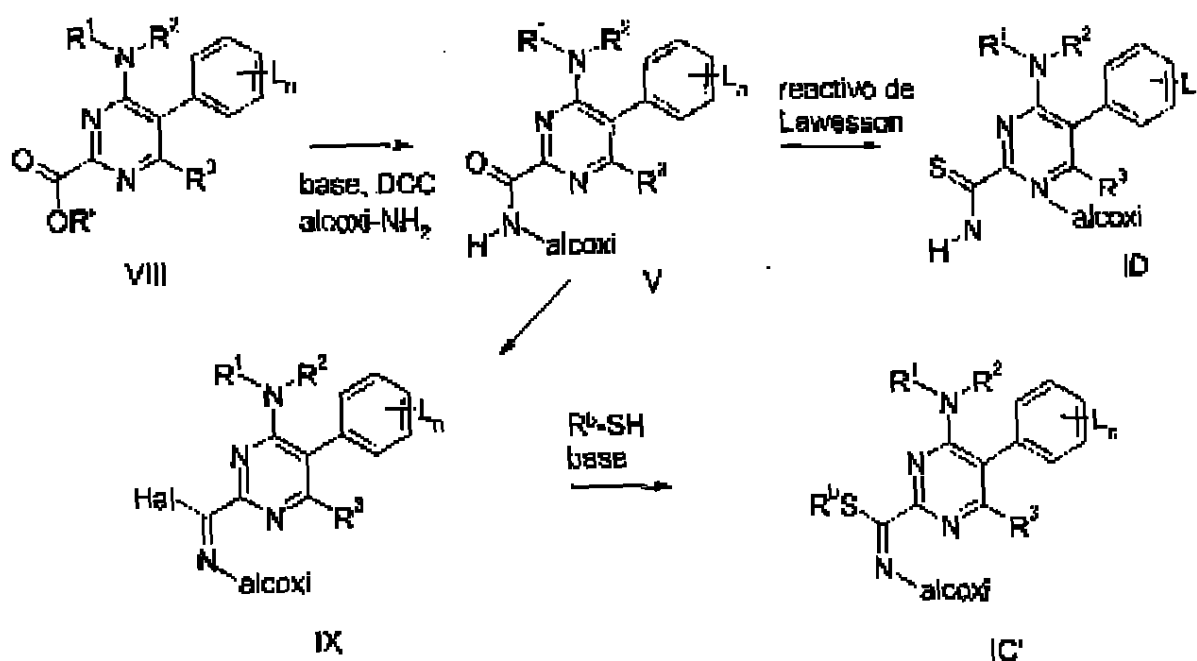
Partiendo del nitrilo IV se recupera con alcoxiamina C_1-C_6 bajo condiciones ácidas el derivado de ácido hidroxámico V. La transformación del compuesto de tiona ID puede

15 realizarse, por ejemplo, con pentasulfuro fosfórico o reactivo de Lawesson. Por alquilación con R^b-X , donde R^b tiene los significados antes indicados y X representa un

grupo disociable, como p.ej. haluro, sulfonato o sulfonato, se pueden recuperar los compuestos IC.

Una síntesis alternativa de los compuestos IC' y ID de la invención está representada en el esquema 3.

Esquema 3:



10

La síntesis de los compuestos IC' y ID representada en el esquema 3 parte del éster de la fórmula VIII. La reacción de VIII con hidroxilaminas dando los ácidos hidroxámicos V puede ser realizada en la forma descrita en Org.Lett., 2001, Vol 3, p. 1053-56 o en J.Org.Chem., 2000, Vol 85, p. 8415-20. La subsiguiente sulfuración puede ser efectuada en analogía a Aust.J.Chem., 1988, Vol. 41, p. 37. Los haluros de imina de la fórmula IX, donde Hal significa halógeno y, especialmente, cloro y bromo, pueden ser preparados en analogía a Synthesis, 1991, Vol 9, p. 750-752. En una reacción de

15

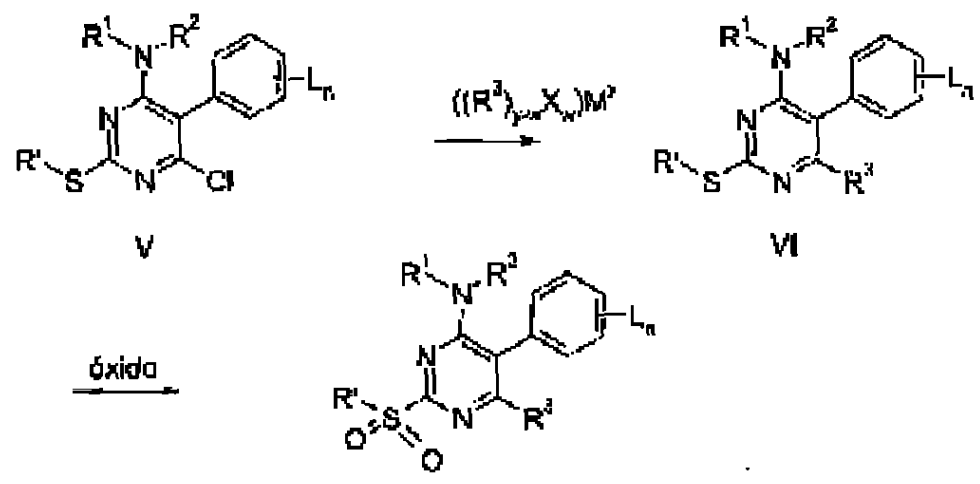
Apel se preparan, por ejemplo con tetrabromuro de hidrógeno y trifenilfosfina, los correspondientes compuestos de bromo. Estos últimos se pueden transformar, finalmente, con mercaptanos de la fórmula R^3SH y bases en los compuestos IC' según la invención.

5

El radical R^3 (especialmente, alquilo) en la posición 6 en el anillo pirimidina se puede incorporar por reacción bajo catálisis con metales transitorios, tales como Ni o Pd . En algunos casos puede ser apropiado invertir el orden e incorporar el sustituyente R^8 antes del sustituyente NR^1R^2 .

10

Esquema 4:



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

- 15 B, Zn, Mg, Cu o Sn, X representa cloro, bromo, yodo o hidroxilo, R^3 significa, preferentemente, alquilo C_1-C_4 y w es un número entero de 0 a 3. Esta reacción puede ser efectuada, por ejemplo, en analogía a los siguientes métodos: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), loc. cit. 1, 2345 (1996); WO-A 89/41255; Aust. J. Chem., Vol. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Vol. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 20 868 (1979); Tetrahedron Lett., Vol. 34, 8267 (1993); loc. cit., Vol. 33, 413 (1992). R^1

significa en las fórmula arriba indicadas, especialmente alquilo C₁-C₆ eventualmente sustituido o fenilo eventualmente sustituido.

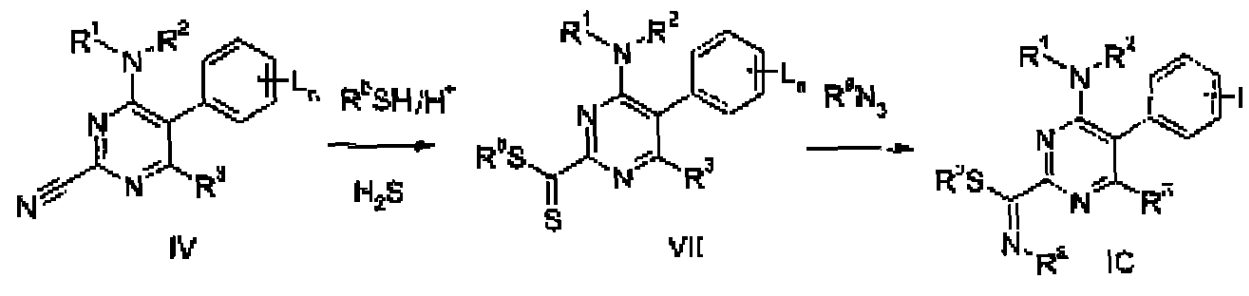
Pirimidinas que en la posición 2 llevan un radical R⁴:

5



donde R² significa alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo, pueden ser preparado, por ejemplo, también según el siguiente método de síntesis:

Esquema 5:

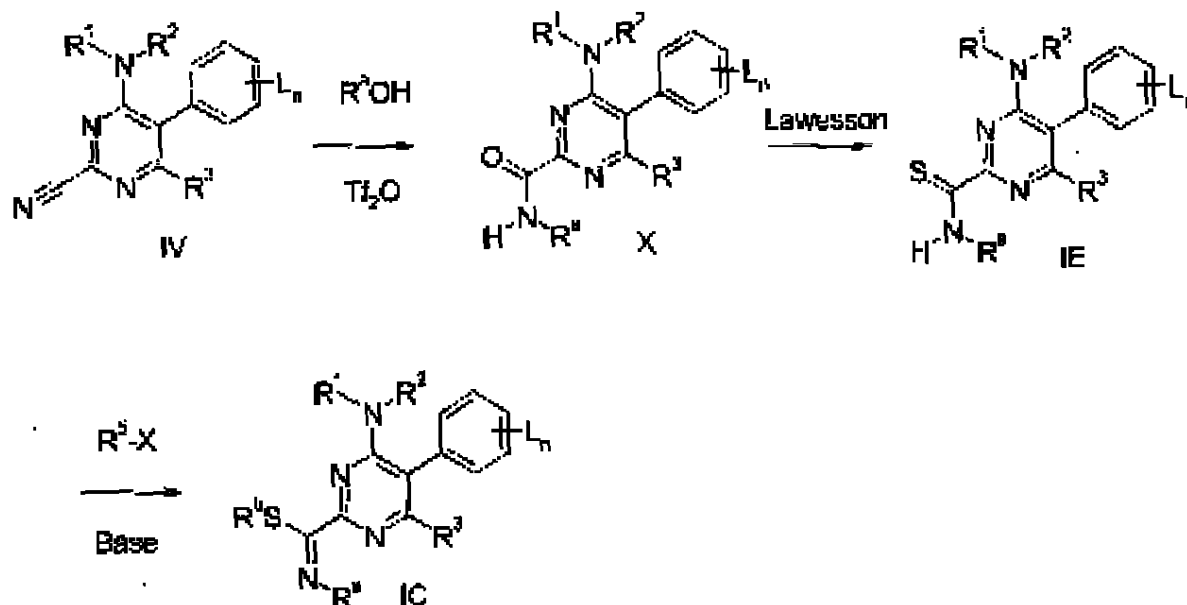


10

A como está representado en el esquema 5, se pueden transformar los nitrilos IV antes descritos con mercaptanos R^bSH, donde R^b tiene los significados antes indicados, bajo condiciones ácidas (ver Chem.Ber., 1980, Vol 113, p. 1898). En otra reacción con azidas, se puede introducir el radical R^a-N, donde R^a tiene los significados antes indicados (s. Pol.J.Chem., 2001, Vol 75, 3.975-82).

15

Esquema 8:



- 5 En el esquema 8 está representado un método de síntesis alternativo de los compues-
to según la invención IC. Partiendo de nitrilos de la fórmula IV se recupera en una re-
acción de Ritter modificada mediante alcoholes de la fórmula R³-OH y anhídrido de
ácido trifluoroacético, amidas de la fórmula X (ver. Tetrahedron Lett., 1989, Vol 30, p.
581-82). La sulfuración con reactivo de Lawesson puede ser realizada según el méto-
10 do descrito en J. Labelled Compd. Rad., 1988, Vol 25, p. 335-343. La alquilación con
R⁵-X, finalmente, se efectúa según los métodos conocidos de la literatura, tal y como
se describe, por ejemplo, en Heterocycles, 1985, Vol 23, p. 2213-15.

- Las indicaciones arriba mencionadas se refieren, especialmente, a la obtención de
15 compuestos, en los que R³ representa un grupo alquilo. Siempre que R³ signifique un
grupo ciano o un sustituyente afoxi, el radical R³ puede ser introducido por reacción
con cianuros de metal alcalino o bien alcoholatos de metal alcalino.

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

5 **halógeno:** flúor, cloro, bromo o yodo;

alquilo: hidrocarburos saturados, lineales o ramificados con 1 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono, por ejemplo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, como p.ej. metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-
10 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;

15

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 6 átomos de carbono (como los arriba mencionados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar sustituidos por átomos de halógeno como los arriba mencionados, p.ej. C₁-C₂ halógenoalquil wie clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetil ó 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

20

alquenilo: radicales hidrocarburo insaturados, lineales o ramificados con 2 a 4 ó 8 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria, p.ej. C_2-C_5 -alquenil como p.ej. etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metilethenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-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;

20

alcadienilo: radicales hidrocarburo insaturados, lineales o ramificados con 4, 6 ó 8 átomos de carbono y dos dobles enlaces en una posición arbitraria;

halógenoalquenilo: radicales hidrocarburo insaturados, lineales o ramificados con 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria (como los arriba

25

mencionados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o completamente sustituidos por átomos de halógeno como los arriba mencionados, especialmente, flúor, cloro y bromo;

- 5 **alquinilo:** grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 8 átomos de carbono y un triple enlace en una posición arbitraria, p.ej. alquinilo C_2-C_8 , como p.ej. etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-
- 10 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;

15

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

- 20 **heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S;**

- **heterocicillo de cinco o seis miembros, que contiene ein a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno**
- 25 **y/o de azufre, p.ej. 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrolieniilo, 3-**

- tetrahidrolenilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridacinilo, 4-hexahidropiridacinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-

hexahidropirimidinilo, 2-piperacínilo, 1,3,5-hexahidro-triacín-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotriacín-3-ilo;

- 5 - heteroarilo 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 heteroarilo pentacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros del anillo, p.ej. 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;
- 10
- 15 - heteroarilo de seis miembros, que contiene uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo hexacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros del anillo, p.ej. 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridacínilo, 4-piridacínilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-piracínilo, 1,3,5-triacín-2-ilo y 1,2,4-triacín-3-ilo;
- 20

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

En lo sucesivo se describe la invención en más detalle.

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

5 ciones:

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

- 10 Son especialmente preferidos los compuestos, en los que R^1 significa alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o halógenoalquilo C_1-C_6 ramificados en la posición α .

Además, son preferidos los compuestos I, en los que R^1 significa halógenoalquilo C_1-C_2 y R^2 significa hidrógeno.

15

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

- 20 Son especialmente preferidos los grupos NR^1R^2 como p.ej. pirrolidinas o piperidinas metiladas, especialmente, en la posición α . Además, se prefiere la 4-metilpiperidina.

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

25

n es 1 a 3

L es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_{10} , alquiniloxi C_2-C_{10} , $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$ o $S(=O)_m-A$:

m es 0, 1 o 2;

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cuyos radicales orgánicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por ciano o alcoxi C_1-C_4 , o A y A' pueden formar junto con los átomos, a los que están ligados un heterociclo de cinco a seis miembros saturado, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N, o S.

15

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

L es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$,

20

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 .

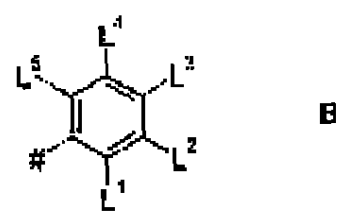
Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^u significa halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_{10} ,

25

alquinoxio C_2-C_{10} , $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, pudiendo los grupos alifáticos o alicíclicos a su vez estar parcial o completamente halogenados.

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^2 significa halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , alquinoxio C_2-C_6 , alquinoxio C_2-C_6 .

Además, son preferidas las pirimidinas I, en las que el grupo fenilo sustituido por L^1 representa el grupo B



10

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

- L^1 significa flúor, cloro, CH_3 o CF_3 ;
- L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno, CH_3 o flúor;
- L^3 es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $CO-NH_2$, $CO-NHCH_3$, $CO-NHC_2H_5$, $CO-N(CH_2)_2$, $NH-C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ o $COOCH_3$ y
- L^5 es hidrógeno, flúor, cloro o CH_3 .

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

PF 54728

20

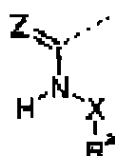
Además, son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^2 significa halógeno,

ciano, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 .

- 5 Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R^3 significa metilo, ciano, metoxi o, especialmente, cloro.

Con respecto a su efecto son apropiadas las pirimidinas de la fórmula I, en la que R^4 significa

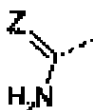
10



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

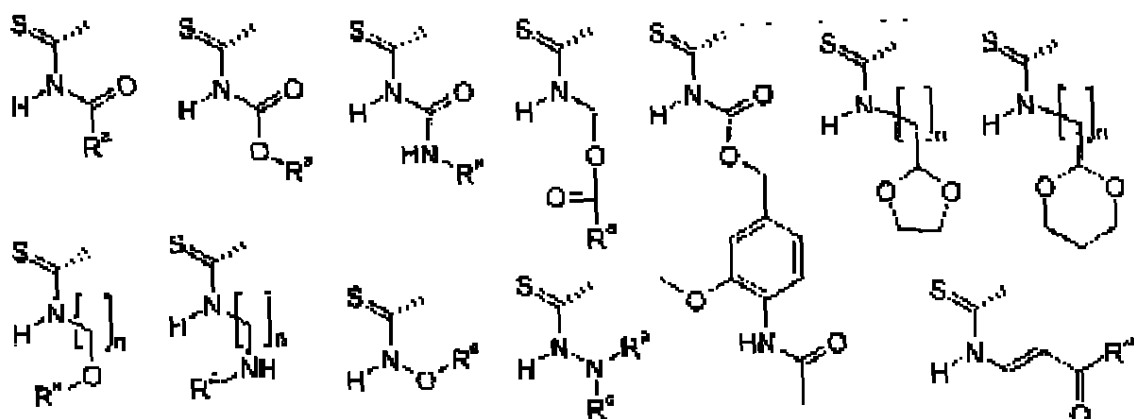


- 15 Son especialmente preferidas las pirimidinas de la fórmula I, en la que R^4 significa



Finalmente, R^4 puede tener, preferentemente, las siguientes definiciones, que también pueden considerarse definiciones de radicales prodrug (ver Medicinal Research Re-

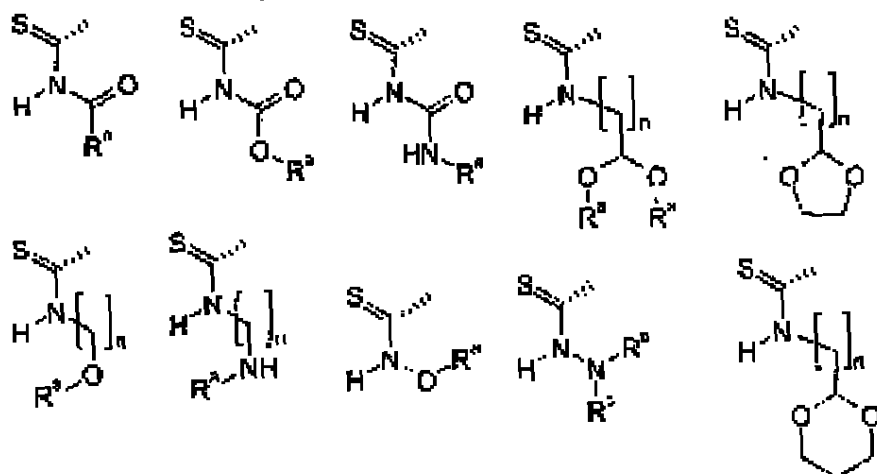
- 20 views 2003, 23, 763 - 793, o J. of Pharmaceutical Sciences 1997, 86, 765-767):



El índice n en los radicales fenilo de las fórmulas arriba representadas representa un número entero de 1 a 3.

5

Son especialmente preferias las definiciones de los radicales R^1 :

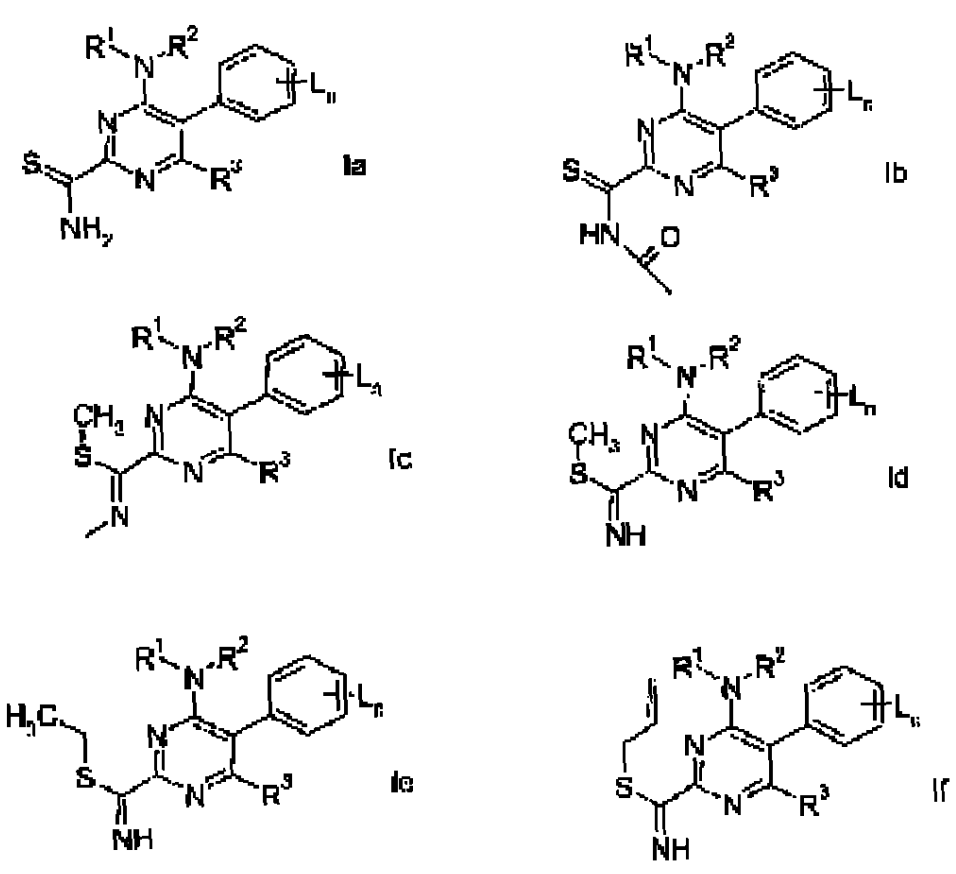


El miembro de puente X representa, preferentemente un enlace directo y $-(C=O)-$.

- 10 El sustituyente R^8 representa, preferentemente, hidrógeno, metilo, alilo o propargilo y muy preferentemente, hidrógeno.

El sustituyente R^b representa, preferentemente, hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o alquenilo C_2-C_6 y, especialmente, metilo, alilo o propargilo.

El sustituyente R³ representa, preferentemente, hidrógeno o metilo.



5 Tabla 1

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 6-cloro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

10 Tabla 2

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

Tabla 3

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dicloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 4

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 6-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 5

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trifluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 6

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-fluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 7

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-metoxicarbonilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

24

Tabla 8

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-CN, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 9

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,5-trifluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 10

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-dicloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 11

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 12

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 13

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-difluoro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 14

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-cloro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 15

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro-4-fluoro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 16

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,3-difluoro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 17

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-difluoro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 18

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,3,4-trifluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 19

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 20

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-dimetilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 21

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metil-4-cloro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 22

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 23

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dimetilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 24

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trimetilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 25

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-ciano, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 26

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 27

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-metoxi-carbonilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

28

Tabla 28

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-metoxi, R^2 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 29

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-metilo, R^2 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 30

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que es L_n 2-cloro, 4-metoxi-carbonilo, R^2 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 31

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-bromo, R^2 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 32

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-cian, R^2 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 33

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro,4-metoxi, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 34

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,3-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 35

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-dimetilo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 36

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo,4-cian, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 37

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 38

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-metilo, 5-fluoro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 39

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-metilo, 4-metoxi, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 40

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-metilo, 4-metoxicarbonilo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 41

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2,5-dimetilo,4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 42

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-fluoro, 4-bromo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25



Tabla 43

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-fluoro,4-metoxi, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 44

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-fluoro, 5-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 45

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es pentafluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 46

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-fluoro,6-cloro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 47

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,6-difluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 48

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dicloro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

5

Tabla 49

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 6-metilo, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

10

Tabla 50

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trifluoro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

15

Tabla 51

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo,4-fluoro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

20

Tabla 52

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,4-metoxicarbonilo, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

25

Tabla 53

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-fluoro,4-CN, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 54

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2,4,5-trifluoro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 55

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2,4-dicloro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 56

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-cloro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 57

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-fluoro, R³ significa cloro y R⁵, R⁶ corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

34

Tabla 58

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-difluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 59

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-cloro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 60

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro-4-fluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 61

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,3-difluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 62

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-difluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 63

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,3,4-trifluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 64

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 65

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-dimetilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 66

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metil-4-cloro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 67

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-metilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

Tabla 68

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dimetilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 69

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trimetilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 70

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-ciano, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 71

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-metilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 72

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 73

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-metoxi, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

5

Tabla 74

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-metiló, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

10

Tabla 75

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-metoxicarbonilo, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

15

Tabla 76

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-bromo, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

20

Tabla 77

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-ciano, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

25

PF 54728

38

Tabla 78

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro, 4-metoxi, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

6

Tabla 79

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 3-metilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 80

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-dimetilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 81

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-ciano, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 82

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-bromo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 83

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 5-fluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 84

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-metoxi, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 85

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ia y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-metoxicarbonilo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 86

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-dimetilo, 4-bromo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 87

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ia y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-bromo, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 88

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-metoxi, R^2 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 89

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 5-metilo, R^2 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 90

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es pentafluoro, R^2 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 91

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 6-cloro, R^2 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 92

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro, R^2 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 93

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dicloro, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 94

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 6-metilo, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 95

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trifluoro, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 96

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-fluoro, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 97

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-metoxycarbonilo, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 98

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-CN, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

5

Tabla 99

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,5-trifluoro, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

10

Tabla 100

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-dicloro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

15

Tabla 101

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

20

Tabla 102

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

Tabla 103

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-difluoro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

5

Tabla 104

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-cloro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

10

Tabla 105

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro-4-fluoro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

15

Tabla 106

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,3-difluoro, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

20

Tabla 107

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-difluoro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

25

Tabla 108

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n 2,3,4-trifluoro, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 109

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10 Tabla 110

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-dimetilo, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15 Tabla 111

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metil-4-cloro, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20 Tabla 112

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-metilo, R³ es metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

45

Tabla 113

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,6-dimetilo, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 114

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,4,6-trimetilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 115

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,6-difluoro-4-ciano, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 116

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,6-difluoro-4-metilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 117

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,6-difluoro-4-metoxi-carbonilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 118

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-cloro, 4-metoxi, R^5 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 119

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-cloro, 4-metilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 120

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-cloro, 4-metoxi-carbonilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 121

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-cloro, 4-metoxi, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 122

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-cloro, 4-ciano, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 123

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro, 4-metoxi, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 124

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 3-metilo, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 125

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-dimetilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 126

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-ciano, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 127

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-bromo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 128

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-metilo,5-fluoro, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 129

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-metilo,4-metoxi, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 130

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-metilo,4-metoxicarbonilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 131

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2,5-dimetilo, 4-bromo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 132

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_1 es 2-fluoro,4-bromo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 133

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,4-metoxi, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 134

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 5-metilo, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 135

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es pentafluoro, R^3 es metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 136

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,6-cloro, R^3 significa clano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 137

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 138

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dicloro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 139

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,6-metilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 140

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trifluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 141

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-fluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 142

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,4-metoxycarbonilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

51

Tabla 143

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-CN, R^5 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 144

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,5-trifluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 145

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-dicloro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 146

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 147

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 148

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4-difluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 149

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro-4-cloro, R^3 significa clano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 150

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro-4-fluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 151

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,3-difluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 152

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-difluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 153

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2,3,4-trifluoro, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

5

Tabla 154

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

10

Tabla 155

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2,4-dimetilo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

15

Tabla 156

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-metil-4-cloro, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

20

Tabla 157

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-fluoro-4-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A .

25

Tabla 158

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-dimetilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 159

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,4,6-trimetilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 160

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-ciano, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 161

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-metilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 162

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

55

Tabla 163

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro,4-metoxi, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 164

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro, 4-metilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 165

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro,4-metoxicarbonilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 166

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro,4-bromo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 167

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-cloro,4-cian, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

26

Tabla 168

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_r es 2,6-difluoro,4-metoxi, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 169

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro,3-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 170

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-dimetilo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 171

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-ciano, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 172

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-bromo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

Tabla 173

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 5-fluoro, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 174

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-metoxi, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 175

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-metilo, 4-metoxicarbonilo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla 176

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2,5-dimetilo, 4-bromo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

20

Tabla 177

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L_n es 2-fluoro, 4-bromo, R^3 significa ciano y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

25

PF 54728

58

Tabla 176

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-fluoro, 4-metoxi, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

5

Tabla 179

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es 2-fluoro, 5-metilo, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

10

Tabla 180

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie y If, en los que L₁ es pentafluoro, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A.

15

Tabla A

No.	R ¹	R ²
A-1.	CH ₂ CH ₃	H
A-2.	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-3.	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-4.	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-5.	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-6.	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-7.	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-8.	CH ₂ CH ₂ F	H
A-9.	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃
A-10.	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₃
A-11.	CH ₂ CF ₃	H
A-12.	CH ₂ CF ₃	CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-13.	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-14.	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15.	CH ₂ CCl ₃	H
A-16.	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-17.	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-18.	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-19.	CH(CH ₃) ₂	H
A-20.	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-21.	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-22.	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23.	CH ₂ C(CH ₃) ₂	H
A-24.	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-25.	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-26.	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A-27.	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-28.	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29.	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂	H
A-30.	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-31.	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-32.	⊗ CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-33.	⊗ CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-34.	⊗ CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-35.	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-36.	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-37.	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-38.	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-39.	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-40.	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-41.	⊗ CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-42.	⊗ CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-43.	⊗ CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-44.	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-45.	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-46.	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-47.	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-48.	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-49.	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-50.	⊕ CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-51.	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-52.	⊕ CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-53.	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-54.	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-55.	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-56.	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-57.	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-58.	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-59.	⊕ CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-60.	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-61.	⊕ CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-62.	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-63.	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-64.	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65.	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-66.	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-67.	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-68.	⊕ CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-69.	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-70.	⊕ CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-71.	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-72.	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-73.	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-74.	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-75.	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-76.	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-77.	ciclopentil	H
A-78.	ciclopentil	CH ₃
A-79.	ciclopentil	CH ₂ CH ₃
A-80.	ciclohexil	H
A-81.	ciclohexil	CH ₃
A-82.	ciclohexil	CH ₂ CH ₃
A-83.	-(CH ₂) ₄ -	
A-84.	(±) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-85.	(R) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-86.	(S) -(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	

No.	R ¹	R ² . . .
A-87.	$-(CH_2)_2-CH(OCH_3)-CH_2-$	
A-88.	$-(CH_2)_2-CH(CH_2CH_3)-CH_2-$	
A-89.	$-(CH_2)_2-CH[CH(CH_3)_2]-CH_2-$	
A-90.	$(\pm) -(CH_2)_3-CH(CH_3)-$	
A-91.	$(\pm) -CH(CH_3)-(CH_2)_2-CH(CH_3)-$	
A-92.	$-CH_2-CH=CH-CH_2-$	
A-93.	$-(CH_2)_5-$	
A-94.	$(\pm) -(CH_2)_4-CH(CH_3)-$	
A-95.	$-(CH_2)_2-CH(CH_3)-(CH_2)_2-$	
A-96.	$(\pm) -(CH_2)_5-CH(CH_3)-CH_2-$	
A-97.	$(R) -(CH_2)_3-CH(CH_3)-CH_2-$	
A-98.	$(S) -(CH_2)_3-CH(CH_3)-CH_2-$	
A-99.	$-(CH_2)_2-C(O[CH_2]_2O)-(CH_2)_2-$	
A-100.	$(CH_2)_2 \triangle CH_2$	
A-101.	$-(CH_2)_2-C(O[CH_2]_3O)-(CH_2)_2-$	
A-102.	$-(CH_2)_2-CH=CH-CH_2-$	

Los compuestos I son apropiados como fungicidas. Se destacan por ser excelente-
mente efectivos contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, especialmente,
de la clase de los *ascomicetos*, *deuteromicetos*, *omicetos* y *basidiomicetos*. En parte
5 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, pasfo, plátanos, al-
10 godón, soya, café, caña de azúcar, vid, frutas y plantas de adorno y legumbres, tales
como frijoles, tomates y cucurbitáceas, así como en las semillas de estas plantas.

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
 - especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
 - *Blumeria graminis* (oidio) en cereales,
 - *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- 5
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
 - especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
 - especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
 - *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
 - *Plasmopara viticola* en vid,
- 10
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
 - *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
 - especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
 - especies de *Puccinia* en cereales,
 - *Pyricularia oryzae* en arroz,
- 15
- especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
 - *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
 - *Uncinula necator* en vid,
 - especies de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, así como
 - especies de *Venturia-Asten* (roña) en manzanas y peras.

20

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

Los compuestos I se aplican, tratando los hongos o las plantas, semillas, materiales o 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.

5

Generalmente, los productos fungicidas contienen de entre 0,1 y 95, preferentemente, 0,5 y 80% en peso de ingrediente activo.

10 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.

15 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.

20

Los compuestos I puedan 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 sobre la superficie.

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 esta fin:

5

agua, disolventes aromáticos (p.ej. productos Solvesso, xileno), parafinas (p.ej. fracciones de petróleo), alcoholes (p.ej. metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grasos y ésteres grasos. Básicamente, se puedan usar también mezclas de disolventes,

10

15

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

20

25

Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isoctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poligl-

col éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilanio, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lías residuales lignino-sulfúricas 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.

15

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

20

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

25

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
5 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

10 partes en peso de los principios activos son disueltas 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.

15 B) Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de los principios activos son disueltas en ciclohexanona adicionando un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión.

20

C)) Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de los principios activos son disueltas 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)

- 5 40 partes en peso de los principios activos son disueltas 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 (Ultraturax) y transformada en una emulsión homogénea. Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión.

10

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
15 suspensión fina de ingrediente activo. Diluyendo con agua, se obtiene una suspensión estable del ingrediente activo.

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

- 20 50 partes en peso de los principios activos son molidas finemente, adicionando dispersantes y humectantes, y transformadas 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.

25

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

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

2. Productos para la aplicación directa

H) Polvos pulverizables (DP)

10

5 partes en peso de los principios activos son molidas finamente y mezcladas íntima-
mente con 95% de un coadyuvante finamente dividido. Se obtiene un polvo pulverizable.

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

15

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

20 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.

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

- Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (povos pulverizables, dispersiones de aceite) 10 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 15 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 20 1%.

- Los principios activos también pueden ser usado con éxito en el procedimiento de volumen ultrabajo (ULV), pudiéndose aplicar formulaciones con más del 95% en peso de ingrediente activo, o 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 5 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 10 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 puedan mezclar los compuestos según la invención sirve para ilustrar las combinaciones posibles, pero no debe entenderse 15 como limitativa:

- acilalaninas, tales como Benalaxyl, Metalaxyl, Oturace, Oxadixyl,
- derivados de amina, tales como Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, 20 Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
- anilinoimidinas, tales como Pyrimethanil, Mepanipyrim o Cyrodinyl,

- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomina,
- azoles, tales como Biteranol, Bromconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalilo, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Procloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- dicarboximidas, tales como Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- ditiocarbamatos, tales como Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, polycarbamato, Thiram, Ziram, Zineb,
- compuestos heterociclicos, tales como anilacina, Benomilo, Boscalid, Carbendazim, carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Ditanona, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuboridazol, Flutolanilo, Furametpir, Isoprothiolan, Mepronilo, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, pirfenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Siltiofam, Thlabendazol, Thifluzamid, Tiofanato-metilo, Tiadinyl, Tricyclazol, Triforine,
- fungicidas de cobre, tales como caldo de burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, nitroftal-isopropilo,

PF 54728

72

- fenilpíroles, tales como Fenpiclonyl o Fludloxonyl,
- azufre,
- 5 • otros fungicidas, tales como Acibencenoar-S-metilo, Benthiavalicarb, Carpropamid, clorothalonilo, Cyflufenamid, Cymoxanilo, Dazomet, diclomezin, diclocymet, dieto-fencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fenlin-acetato, Fenoxanyl, Ferim-zone, Fluazinam, Fosethyl, Fosethyl-aluminio, Iprovalicarb, hexaclorobenceno, Me-trafenon, Pancycuron, Propamocarb, Italida, Toloclofos-metilo, Quintozena, Zoxa-
- 10 mid,
- estrobilurinas, tales como Azoxistrobin, Dimoxistrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-metilo, Metaminostrobin, Orysastrobin, Picoxistrobin, Pyraclostrobin o Trifloxistrobin,
- 15 • derivados de ácido sulfénico, tales como Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolilfluanid,
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como Dimetomorph, Flumetover o Flumorph.

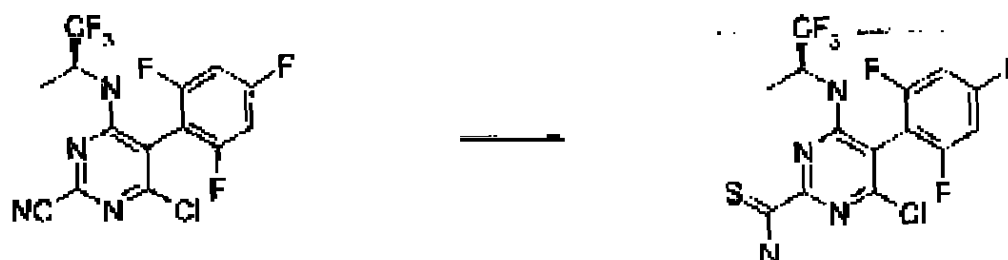
20

Ejemplos de síntesis

Ejemplo 1: Síntesis de (S)-4-cloro-6-(2,2,2-trifluoro-1-metil-etilamino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pirimidin-2-tiocarbamida

PF 54728

73



En una solución de 0.5 g (1.35 mmol) de (5)-4-cloro-6-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil-
amino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pirimidin-2-carbonitrilo, preparado según la WO

03/043993, en 0.16 g de trietilamina y 6 ml de N-metilpirrolidona se introducen a tem-

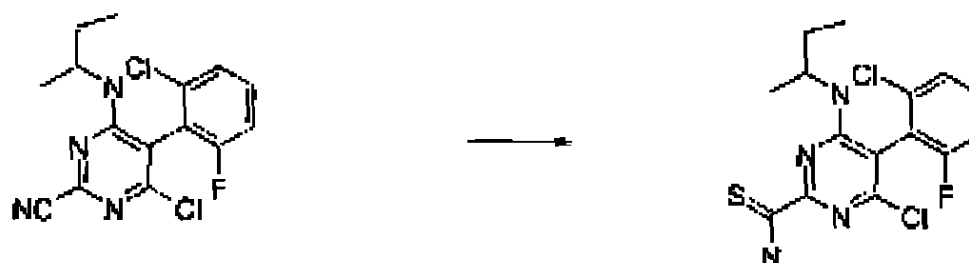
5 peratura ambiente durante cinco minutos sulfuro de hidrógeno. Terminada la reacción,
se adicionan 20 ml de agua, se neutraliza la mezcla con ácido acético, se extrae con
éter metil-terc.-butilico, se lava la fase orgánica con agua, se seca sobre sulfato de
magnesio y se seca.

Rendimiento: 0.44 g (81 % de la teoría)

10 p.f.: 101-103°C

Ejemplo 2: Síntesis de 4-sec-butilamino-6-cloro-5-(2-cloro-6-fluoro-fenil)-pirimidin-2-

tiocarbamida



15 En una solución de 1.0 g (2.9 mmol) de 4-sec-butilamino-6-cloro-5-(2-cloro-6-fluoro-
fenil)-pirimidin-2-carbonitrilo en 0.36 g de trietilamina y 12 ml de N-metilpirrolidona se
introduce a temperatura ambiente durante cinco minutos sulfuro de hidrógeno. Termi-
nada la reacción, se adicionan 20 ml de agua, se neutraliza la mezcla con ácido acéti-

PF 54728

74

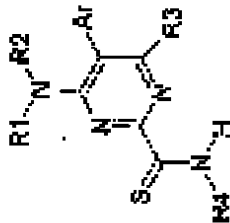
co, se extrae con éter metil-terc.-butilico, se lava la fase orgánica con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se seca.

Rendimiento: 0.57 g (53 % de la teoría)

p.f.: 147-150°C

5

Los compuestos indicados en la siguiente Tabla se sintetizaron análogamente a las prescripciones arriba indicadas .



No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Ar	m.p.: [°C]	¹ H-NMR (ppm, CHCl ₃)
I-1	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)	CH ₂ CH ₂	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl	170-172	
I-2	(S)-CH(CH ₂)CF ₃	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	101-103	
I-3	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenyl		1.21 (d, 6H); 4.42 (m, br, 2H); 7.21 (t, 1H); 7.36 (m, 2H); 8.03 (s, br, 1H); 9.12 (s, br, 1H)
I-4	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	145-149	
I-5	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	110-113	
I-6	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl		1.27 (d, 3H); 1.6 (m, 4H); 3.92 (m, 2H); 4.48 (m, 1H); 6.76 (m, 2H); 7.80 (s, br, 1H); 9.04 (s, br, 1H)
I-7	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	H	2,4,6-trifluorophenyl	130-132	

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Ar	¹ p.f.: [°C]	¹ H-NMR (ppm, CHCl ₃)
I-8	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₃	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenilo	147-150	
I-9	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenilo		1.03 (m, 3H); 1.45 (s, 3H); 3.24 (m, 1H); 3.50 (m, 1H); 3.83 (m, 2H); 4.79 (s, 2H); 7.10 (m, 1H); 7.36 (m, 2H); 8.00 (s, br, 1H); 9.06 (s, br, 1H)
I-10	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenilo		0.88 (dd, 6H); 1.20 (dd, 3H); 1.79 (m, 1H); 4.45 (m, br, 2H); 7.20 (m, 1H); 7.43 (m, 2H); 7.70 (s, br, 1H); 9.08 (s, br, 1H)
I-11	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-chloro-4-fluorophenilo		0.85 (dd, 6H); 1.15 (dd, 3H); 1.75 (m, 1H); 4.40 (m, br, 2H); 7.19 (m, 1H); 7.33 (m, 2H); 8.03 (s, br, 1H); 9.11 (s, br, 1H)
I-12	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2,4-Difluorophenilo		0.84 (dd, 6H); 1.16 (dd, 3H); 1.76 (m, 1H); 4.30 (m, br, 2H); 7.00 (m, 1H); 7.08 (m, 1H); 7.38 (m, 1H); 8.0 (s, br, 1H); 9.0 (s, br, 1H)
I-13	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	2,4,6-trifluorophenilo	54-50	
I-14	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	Cl	H	2-chloro-6-fluorophenilo	120-123	
I-15	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2,4,6-trifluorophenilo	142-145	
I-16	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂		Cl	H	2,4,6-trifluorophenilo	66-69	

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Ar	p.f.: [°C]	¹ H-NMR (ppm, CHCl ₃)
I-17	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	Cl	COCH ₃	trifluorofenilo	55-58	
I-18	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	Cl	H	2,4,6-trifluorofenilo		1.34 (m, 3H); 4.4 (d, 1H); 4.84 (m, 1H); 7.19 (m, 1H); 7.31 (m, 2H); 8.31 (s, 1H); 8.92 (s, 1H); 11.61 (s, 1H)
I-19	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	H	2,4,6-trifluorofenilo		1.03 (m, 6H); 3.37 (m, 4H); 6.8 (m, 2H); 8.03 (m, 1H); 9.02 (m, 1H)
I-20	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	2-cloro-4-fluorofenilo		0.85 (m, 3H); 1.1 (m, 3H); 1.7 (m, 1H); 4.03 (s, 1H); 4.35 (d, 1H); 7.17 (m, 1H); 7.33 (m, 2H); 7.7 (s, 1H); 8.86 (s, 1H); 11.39 (s, 1H)
I-21	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	COCH ₃	2,4,6-trifluorofenilo		1.07 (m, 6H); 2.65 (s, 3H); 3.37 (m, 4H); 6.83 (t, 2H); 11.62 (s, 1H)
I-22	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	2-cloro-4-fluorofenilo	172-175	
I-23	CH(CH ₃) ₂	H	Me	H	2,4,6-trifluorofenilo	159	
I-24	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Me	H	2,4,6-trifluorofenilo	114-117	
I-25	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		Me	H	2,4,6-trifluorofenilo	149-151	

Ejemplos del efecto contra hongos nocivos

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

5

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

10

Ejemplos de aplicación

- 1) Ejemplo de aplicación 1 - Eficiencia contra el moho gris en hojas de pimienta causado por *Botrytis cinerea* en la aplicación protectora

15

Plántulas de pimienta de la variedad "Neusiedler Ideal Elite" fueron pulverizadas hasta chorrear, después de que se habían desarrollado bien 4 a 5 hojas, con una suspensión acuosa con la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente, se inocularon las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea*, que contenía $1,7 \times 10^8$ esporas/ml en una solución acuosa al 2% de biomafita. 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 infección por el hongo en %.

20
25

En este ensayo, las plantas tratadas con los compuestos I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-10 y I-11 no presentaban ninguna infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90%.

- 5 2) Eficiencia contra el oidio en pepinos causado por *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 (10 *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.

15 ción de la superficie de hoja cotiledónea.

En este ensayo, las plantas tratadas con los compuestos I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10 y I-11 no presentaban ninguna infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 100%.

20

3. Eficiencia contra la marchitez temprana del tomate causada por *Alternaria solani*

Las hojas de plantas de tomate de la variedad "Goldene Prinzessin" se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa de una concentración en principio activo de (25 250 ppm. Al día siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de espo-

ras de *Alternaria solani* en 2 % de solución de biomalta con una densidad de 0.17×10^5 esporas/ml. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 20 y 22°C. Después de 5 días se había desarrollado tan fuertemente la enfermedad en las plantas de control no tratadas pero infectadas, que se pudo determinar el grado de infección en por cien.

En este ensayo, las plantas tratadas con los compuestos I-13, I-14, I-15, I-16, I-17 y I-19 presentaban una infección de <5 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 80 %

10

4. Eficiencia contra la mancha reticular de la cebada causada por *Pyrenophora teres*.

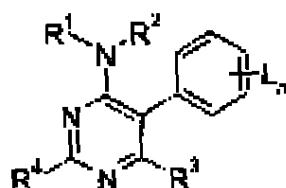
Las hojas de plántulas de cebada crecidas en macetas de la variedad "Hanna" se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa en una concentración de principio activo de 250 ppm. 24 horas después de estar seca la capa pulverizada se inoculaban las plantas de ensayo con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *teres*, el patógeno de la mancha reticular. A continuación, se colocaron las plantas de ensayo en el invernadero a temperaturas de entre 20 y 24°C y a 95 hasta 100 % de humedad relativa del aire. Después de 6 días se determinó visualmente la extensión del desarrollo de la infección en % de la superficie total de.

En este ensayo, las plantas tratadas con los compuestos I-13, I-14, I-15, I-16, I-17 y I-19 presentaban una infección de <10 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 80 %.

25

Reivindicaciones

1. Pirimidinas 2-sustituídas de la fórmula I



I

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

n es un número entero de 1 a 5;

10 L significa halógeno, ciano, cianato (OCN), -alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinoxil C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₂-C₆, cicloalquinoxil C₃-C₆, cicloalquenilo C₂-C₆, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A,

15 m es 0, 1 ó 2;

20 A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₂-C₆, fenilo, cuyos radicales orgánicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por nitro, cianato, ciano o C₁-C₆-alcoxi; o A y A' pueden formar junto con los átomos a los que están ligados un heterociclo de cinco a seis miembros saturado, no saturado,

do o aromático, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O,
N o S;

5 pudiendo los grupos alifáticos de las demás definiciones de I, estar parcial
o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u :

R^u significa ciano, alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_2-C_6 , alquenilo C_2-C_3 , al-
quinilo C_2-C_5 , cicloalquenilo C_4-C_6 , cicloalquiloxi C_3-C_6 , cicloalqueni-
loxi C_4-C_6 , $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A'')(=N-OA)$,
10 $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_{1-4}-A$, $S(=O)_m-O-A$ o
 $S(=O)_m-N(A')A$;

R^1, R^2 significan, independientemente, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alqui-
nilo C_2-C_3 , cicloalquilo C_2-C_6 , halógenocicloalquilo C_3-C_6 , pudiendo los gru-
pos alifáticos de las definiciones de los radicales R^1 y R^2 a su parte estar
15 parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u :

R^u R^v ciano, cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_4-C_6 , hidróxi, alcoxi C_1-
 C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquiloxi C_3-
20 C_6 , cicloalqueniilo C_4-C_6 , alquilo C_1-C_3 , $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-$
 $C(=O)-N(A')A$, $C(A'')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-$
 $N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ o $S(=O)_m-N(A')A$ o fenilo, pudiendo la
parte de fenilo llevar uno a tres radicales seleccionados del grupo:
halógeno, alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_5 , cicloalquilo

C_2-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , ciano, nitro, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')X=N-OA$, $N(A')A$;

R^2 puede significar adicionalmente hidrógeno;

5

R^1 y R^2 pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que estén ligados un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter $-(O-)$, carbonilo $-(C=O)$, thio $-(S-)$, sulfoxilo $-(S(=O)-)$ o sulfenilo $-(SO_2-)$ o un grupo amino $-(N(R^3))$ adicional, donde R^3 es hidrógeno o alquilo C_1-C_6 , y/o contener uno o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 y oxialquilenoxi C_1-C_3 ;

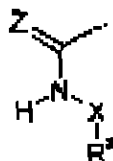
10

R^3 es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , di-(alquil C_1-C_6)amino o alquilamino C_1-C_6 , pudiendo los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo de R^3 estar sustituidos por halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_2 o alcoxicarbonilo C_1-C_4 ;

15

20

R^4 corresponde a una de las fórmulas



en las que

X es un enlace directo, $-(C=O)$, $-(C=O)-NH$, $-(C=O)-O$, $-O$, $-NR^c$, estando cada vez la parte izquierda de la molécula ligado con el átomo de nitrógeno;

5 R^d es hidrógeno, metilo, bencilo, trifluorometilo, alilo, propargilo o metoximetilo;

R^h es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquinilo C_2-C_6 ;

10 R^e es hidrógeno, metilo o acilo C_1-C_4

Z es S o NR^h ;

15 pudiendo los grupos alifáticos de las definiciones de los radicales R^g , R^f y/o R^h a su vez llevar uno o dos grupos R^m :

R^m significa halógeno, OR^f , NHR^f , alquilo C_1-C_6 , alcóxicarbonylo C_1-C_2 , acilamino C_1-C_4 , [1,3]dioxolano -alquilo- C_1-C_4 , [1,3]dioxano -alquilo- C_1-C_4 , significando

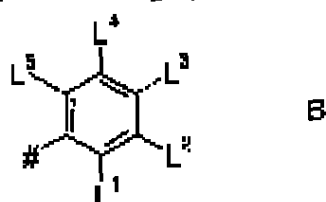
20

R^k es hidrógeno, metilo, alilo o propargilo.

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

3. Pirimidinas 2-sustituidas según la reivindicación 1, donde R^3 significa hidrógeno y
5 y R^5 significa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o alquenilo C_2-C_9 .

4. Pirimidinas 2-sustituidas según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde el grupo fenilo sustituido por L , representa el grupo B



10 donde $\#$ es el lugar de enlace con es esqueleto de pirimidina y

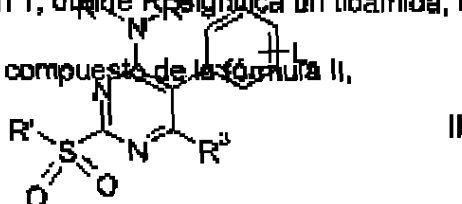
L^1 significa flúor, cloro, CH_3 ó CF_3 ;

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

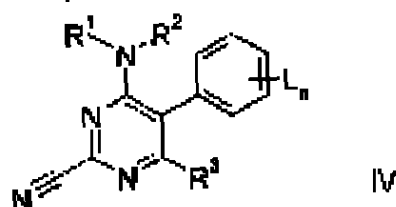
L^3 es hidrógeno, flúor, cloro, ciano, CH_3 , SCH_3 , OCH_3 , SO_2CH_3 , $NH-$
15 $C(=O)CH_3$, $N(CH_3)-C(=O)CH_3$ oder $COOCH_3$ und

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

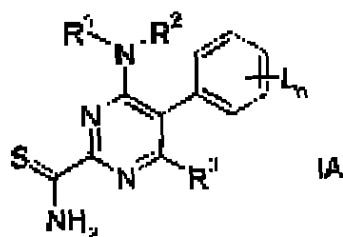
5. Procedimiento para la obtención de pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula I según la reivindicación 1, donde R^3 significa un tioamida, caracterizado porque se
20 hace reaccionar un compuesto de la fórmula II,



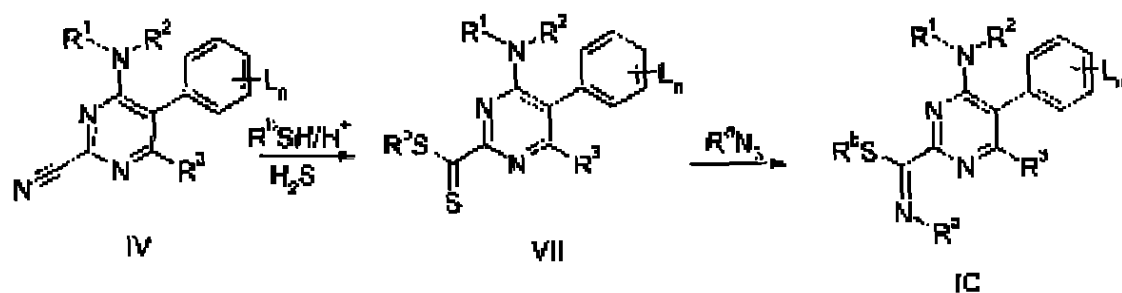
en la que los sustituyentes L , R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y R^1 significa un radical alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, eventualmente sustituido, o un radical fenilo eventualmente sustituido, con un cianuro de metal alcalino o alcalinotérreo o cianuro de cinc de la fórmula (III), y luego se transforma el compuesto IV obtenido



con sulfuro de hidrógeno en IA

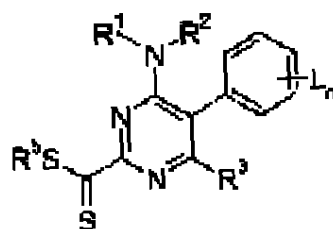


6. Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula IC, donde los sustituyentes L_n , R^1 , R^2 , R^3 , R^a y R^b tienen las definiciones indicadas en la reivindicación 1



partiendo de nitrilo IV por reacción con mercaptanos de la fórmula R^bSH bajo condiciones ácidas y reacción ulterior del éster de ácido ditiocarboxílico obtenido de la fórmula VII con azidas de la fórmula R^cN_3 .

- 5 7. Compuestos de la fórmula VII,



VII

donde los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 , R^b y L_n tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

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

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

572/

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

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

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054728	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA415	
Internationales Aktenzeichen PCT:EP2004/007258	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 03.07.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 24.07.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D239A2		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 38 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfasst insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☐ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um ☐ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.18 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die über aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angegeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enhalten, nur in computerisierter Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 602 der Verwaltungsvorschriften). 4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids ☐ Feld Nr. II Priorität ☐ Feld Nr. III Keine Erteilung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☒ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 11.01.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 26.08.2005	
Namen und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäische Patentamt - Gitschiner Str. 103 D-10964 Berlin Tel. +49 30 25901-0 Fax: +49 30 25901-840	Bevollmächtigter Beauftragter Höpfner, W Tel. +49 30 25921-	

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/007258

Feld Nr. 1 Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
 - ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gehen im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*.

Beschreibung, Seiten

1-52 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-9 in der ursprünglich eingereichten Fassung

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

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

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

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/007258

Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

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, dem 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:
4. Daher ist der Bericht für die folgenden Teile der internationalen Anmeldung erstellt worden:
 - ☒ alle Teile.
 - ☐ die Teile, die sich auf die Ansprüche mit folgenden Nummern beziehen: .

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-9
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche 1-9
	Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche 1-9
	Nein: Ansprüche:
2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):
 siehe Beiblatt

Zu Punkt IV

Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

Das Dokument WO-A-03/043993 (im Folgenden D1 genannt) offenbart lungszid wirksame 2-substituierte Pyrimidine der Formel I, darunter auch Verbindungen, in denen der Rest R¹ die Bedeutung -C(=NOR²)NR³R⁴ hat.

Somit ist das Unterscheidungsmerkmal zwischen den Verbindungen der Formel I aus dem gegenwärtigen Anspruch 1 und den Verbindungen aus D1 zu sehen als

- erstens Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe -C(=Z)-NH-X-R^a substituierten Pyrimidinen, wobei Z die Bedeutung "Stickstoff" hat und
- zweitens Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe -C(=Z)-NH-X-R^a oder -C(=N-X-R^a)-SR^b substituierten Pyrimidinen, wobei Z die Bedeutung "Schwefel" hat.

Jedoch, mit dem Vorhandensein von zwei verschiedenen Unterscheidungsmerkmalen und ohne jegliches gemeinsames strukturelles Merkmal kann der Gegenstand des gegenwärtigen Anspruchs 1 nicht länger als einheitlich im Sinne von Art. 82 EPÜ gesehen werden und muss daher in zwei unterschiedliche Erfindungen aufgeteilt werden (Nichteinheitlichkeit *a posteriori*), die wie folgt lauten:

- Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe -C(=Z)-NH-X-R^a substituierten Pyrimidinen, von Zwischenprodukten und von einem Verfahren zu ihrer Herstellung (erste Erfindung),
- Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe -C(=Z)-NH-X-R^a oder -C(=N-X-R^a)-SR^b substituierten Pyrimidinen, wobei Z die Bedeutung "Schwefel" hat, von Zwischenprodukten und von einem Verfahren zu ihrer Herstellung (zweite Erfindung).

Zu Punkt V

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

- D1: WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30. Mai 2003 (2003-05-30)
D2: WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM ; BASF AG (DE); GEWEHR MARKUS (DE); LORENZ GISELA) 26. September 2002 (2002-09-26)

Neuheit

Dokument D1 offenbart fungizid wirksame 2-substituierte Pyrimidine der Formel I, darunter auch Verbindungen, in denen der Rest R^4 unter anderem die Bedeutung $C(=NOR^a)NR^aR^b$ hat (vgl. Seite 1, Zeilen 4, 5; Seite 1, Formel 1; Seite 2, Zeile 45; Seite 17, Zeile 36 - Seite 19, Zeile 4; Seiten 30-30, Beispiele).

Im gegenwärtigen Anspruch 1 sind zwei *a priori* einheitliche Ausführungsformen beansprucht, nämlich Verbindungen, in denen R^4 die Bedeutung $-C(=Z)-NH-X-R^a$ mit $Z=N$ hat, was als formal neue Auswahl aus D1 gelten kann, da der Rest R^4 in D1 neben $-C(=NOR^a)NR^aR^b$ noch weitere Bedeutungen haben kann, und Verbindungen, in denen R^4 die Bedeutung $-C(=Z)-NH-X-R^a$ mit $Z=S$ oder $-C(=N-X-R^a)-SR^b$ hat, welche durch D1 nicht vorweggenommen werden.

Somit ist für den Gegenstand der unabhängigen Ansprüche 1 und 7-9 sowie der abhängigen Ansprüche 2-4 formal Neuheit gegen D1 anzuerkennen.

Dokument D2 offenbart weitere fungizid wirksame 2-substituierte Pyrimidine, von denen sich die Verbindungen der Formel I aus Anspruch 1 jedoch dadurch unterscheiden, dass der Substituent R^4 aus Formel I von Anspruch 1 acyclisch ist (vgl. Seite 1, Zeilen 2, 3; Seite 1, Formel I; Seite 24, Zeile 14 - Seite 25, Zeile 9; Seiten 35-44, Beispiele).

Erfinderische Tätigkeit

Erste Erfindung:

Unterscheidungsmerkmal ist die neue Auswahl der in 2-Stellung am Pyrimidin befindlichen Gruppe R^4 mit der Bedeutung $-C(=Z)-NH-X-R^a$ mit $Z=N$.

In Abwesenheit von Beweismaterial für einen überraschenden technischen Effekt, der mit diesem Merkmal in Zusammenhang zu bringen wäre, kann die der neuen Auswahl zu Grunde liegende objektive Aufgabe lediglich gesehen werden in der Bereitstellung weiterer Verbindungen mit fungizider Wirkung im Rahmen der allgemeinen Lehre von D1.

Da aber die beanspruchte Lösung dieser sehr allgemeinen Aufgabe in Abwesenheit eines technischen Effektes als willkürliche Auswahl aus D1 anzusehen ist, kann für diese Lösung keine erfinderische Tätigkeit anerkannt werden.

Zweite Erfindung:

Unterscheidungsmerkmal ist die in 2-Stellung am Pyrimidin befindliche Gruppe R^4 mit der Bedeutung $-C(=Z)-NH-X-R^a$ mit $Z=S$ oder $-C(=N-X-R^a)-SR^a$.

Auch hier gilt, dass in Abwesenheit von Beweismaterial für einen überraschenden technischen Effekt die den neuen Merkmalen zu Grunde liegende objektive Aufgabe lediglich gesehen werden kann in der Bereitstellung weiterer Verbindungen mit fungizider Wirkung, weiterer Zwischenprodukte und eines weiteren Verfahrens zur ihrer Herstellung.

Die beanspruchte Lösung dieser sehr allgemeinen Aufgabe bestand in der Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe R^4 substituierten Pyrimidinen, wobei die Gruppe R^4 ein Thiocarbonsäureamid oder dessen Tautomeres darstellt.

Da jedoch diese Lösung dem Stand der Technik nicht entnehmbar war, muss für die obigen neuen Merkmale das Vorhandensein von erfinderischer Tätigkeit anerkannt werden, auch in Abwesenheit eines technischen Effekts.

Gewerbliche Anwendbarkeit

Es besteht kein Zweifel, dass der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1-9 gewerblich anwendbar ist.

Formales

Die konkreten Anwendungsbeispiele sowie die in der Beschreibung und den Ansprüchen genannten Herstellungsverfahren beziehen sich ausschließlich auf solche Verbindungen, in denen "Z" für "Schwefel" steht.

Somit ist Anspruch 1, soweit er sich auf Verbindungen bezieht, in denen "Z" die Bedeutung "Stickstoff" hat, nicht hinreichend durch die Beschreibung gestützt.

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Reserva
Patrimonio Cultural
Nacional

182

Expediente No		06006390	No de Follo
Item		NO de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMANO CARTA X	1	
9	SOBRE BLANCO TAMANO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:

contiene arte final

183

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

HIT : 800126087-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 4,566
FECHA : ENERO 23 DE 2006

FORM CONSIGNACION 31301

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Gr. PAGO
CAVELLER AGOSADGO	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-A	34484409	23/01/2006	36,565,660.00

FORM CONCEPTO 31302

CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 30005-01-01 SOLICITUDES	1 163,000.00
1 163,000.00	1 163,000.00
TOTAL :	\$ 463,000.00

SUM: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APERTURADO AL EXPEDIENTE No. _____

26 00361 - 841-036-9



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

PATENTE DE INVENCION (/)	MODELO DE UTILIDAD ()	USUARIO ()	RADICADOR ()
-Indicación de que se solicita la concesión de una patente. /		()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud. /		()	()
-Descripción de la invención /		()	()
-Dibujos de ser estos pertinentes. /		()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas. /		()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()	()

DISEÑO INDUSTRIAL ()			
-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.		()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.		()	()
-Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.		()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.		()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()	()

ESQUEMA DE TRAZADO ()			
-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.		()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.		()	()
-Representación gráfica del Esquema Trazado.		()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.		()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()	()

Firma Responsable: 
Fecha: ENERO 24 de 2006

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folios ~~184~~

2020
 Bogotá D.C.,

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

REFERENCIA	Radicación No.	06 6390
	Solicitud internacional	EP2004/007258
	Fecha inicio fase nacional	24/02/2006
	Trámite	11
	Rvento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	366
	Folios	1

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

Cúmplase
 Dado en Bogotá DC,

11 APR 2006

ALIX CARMENZA CESPÉDES DE VERGEL
 Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa11