



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

OP

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

06-6393

54. TÍTULO

PIRIMIDINAS 2-SUSTITUIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438,019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 66026393, 030000000. Folios: 176,

Fecha (ACD): 2005-01-24 17:11:49

Trámite : 011 PCT-PATENT 378 FACE PNEI 411 REPRESENTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS OCACIONES

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 Republica Federal de Alemania

Dirección 67056 Ludwigshafen,

República Federal de Alemania

Domicilio Ludwigshafen,

República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C E ☐ Otro ☐

Cual _____

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@camyp.com

Domicilio Bogotá, Colombia

IDENTIFICACIÓN

C C ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 438 019 T P 31 929

4

INVENTOR (ES)

(72)

1. Anja SCHWÖGLER

Heinrich-Lanz-Strasse 3,

68165 Mannheim

República Federal de Alemania
2. Markus GEWEHR

Goethestrasse 21,

56288 Kastellaun,

República Federal de Alemania
3. Bernd MÜLLER

Stockingerstrasse 7,

67227 Frankenthal,

República Federal de Alemania
4. Thomas GROTE

Im Höhnhausen 18,

67157 Wachenheim,

República Federal de Alemania
5. Wassillos GRAMMENOS

Alexander-Fleming-Strasse 13,

67071 Ludwigshafen,

República Federal de Alemania
6. Jordi TORMO I BLASCO

Carl-Benz-Strasse 10-3,

69514 Laudenbach,

República Federal de Alemania
7. Andreas GYPSE

B4 4,

68159 Mannheim,

República Federal de Alemania
9. Carsten BLETNER

Richard-Wagner-Strasse 48,

68165 Mannheim,

República Federal de Alemania
10. Peter SCHÄFER

Römerstrasse 1,

67308 Ottersheim

República Federal de Alemania
11. Frank SCHIEWECK

Lindenweg 4,

67258 Heßheim,

República Federal de Alemania
12. Oliver WAGNER

Im Meisental 50,

67433 Neustadt

República federal de Alemania
13. Reinhard STIERL

Jahnstrasse 8,

67251 Freinsheim,

República Federal de Alemania
14. Ulrich SCHÖFL

Erlenstrasse 8,

68782 Bruhl,

República Federal de Alemania
15. Siegfried STRATHMANN

Donnersbergstrasse 9,

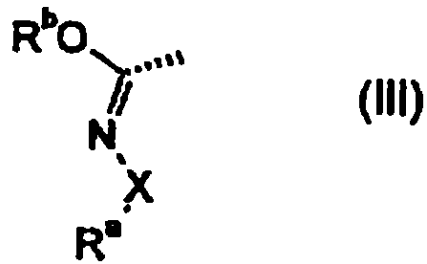
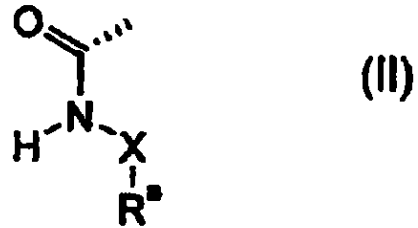
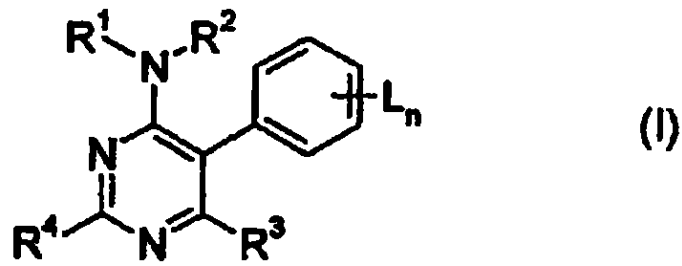
67117 Limburgerhof

República Federal de Alemania

	8. Joachim RHEINHEIMER Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen, República Federal de Alemania	16. Maria SCHERER Hermann-Jurgens-Strasse 30, 76829 Godramstein, República Federal de Alemania									
5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/007877</u> Fecha: <u>15 de julio de 2004</u> Publicación Internacional No <u>WO 2005/012261 A1</u> Fecha: <u>10 de febrero de 2005</u>										
6	TÍTULO (54) <u>PIRIMIDINAS 2-SUSTITUIDAS</u>										
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 239/42</u>										
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	<table border="1"><thead><tr><th>(33) País de Origen</th><th>(32) Fecha</th><th>(31) Número de Solicitud</th></tr></thead><tbody><tr><td><u>DE</u></td><td><u>24/07/2003</u></td><td><u>103 33 857.8</u></td></tr><tr><td><u>DE</u></td><td><u>09/12/2003</u></td><td><u>103 57 714.9</u></td></tr></tbody></table>	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud	<u>DE</u>	<u>24/07/2003</u>	<u>103 33 857.8</u>	<u>DE</u>	<u>09/12/2003</u>	<u>103 57 714.9</u>
(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud									
<u>DE</u>	<u>24/07/2003</u>	<u>103 33 857.8</u>									
<u>DE</u>	<u>09/12/2003</u>	<u>103 57 714.9</u>									
9	Comprobante de pago No.: <u>06 - 4.665</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.oo. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica ☒ Poderes, si fuere el caso ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante ☐ Declaraciones ☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud ☒ Otros VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS										

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE

EMILIO FERRERO

FIRMA :

C C. 438 019 de Usaquén T P 31.929

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2005/012261 A1

Descripción:

Páginas 66 en el idioma original

Páginas 95 en español

Reivindicaciones. Número (s) 14

Figuras: Número (s)

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

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República
Federal de Alemania

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero, y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

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

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

[Firma]
Firma

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

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal
de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832, GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Falle der Hauptvertreter, oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten, oder Kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendeten, einer oder anderen, ordnungsweise 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 dieselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentum zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben, oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Handels-, Defensive- und Service-zeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen- und Zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Namen und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertraglizenz; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmaßnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder denen wir vorantreten; c) damit sie in allen oben bezeichneten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, Regale, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der natürlichen Vertreter bestätigen

Unterzeichnet heute am 17. März 1989.

in D-6700 Ludwigshafen

NOTARIA (E)

[Firma]
Unterschrift

U.R.Nr. 1407/89

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

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

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

Aufgrund heutiger Einsichtnahme in das Handelsregister
beim Amtsgericht Ludwigshafen am Rhein HR B 3000 be-
scheinige ich, daß die Herren Dr. Welzel und Dr. Richters
als Prokuristen gemeinschaftlich zur Vertretung und
Zeichnung der Firma BASF Aktiengesellschaft mit dem
Sitz in Ludwigshafen am Rhein berechtigt sind.

Ludwigshafen am Rhein, den 17. März 1989



Dr. Peter Richters
Prokurist
als amtsgerichtlicher Vertreter
des Herrn Dr. Gunther Welzel

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

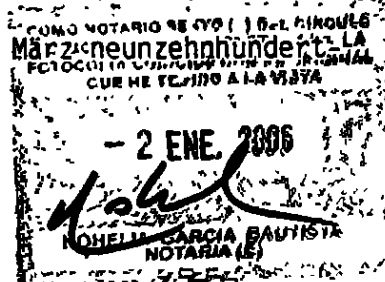
Thomas W a l t e r

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten Märzneunzehnhundertneunundachtzig

Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20,-- DM

LUZ ARRIAGA DE ARPEEN
INSTRUMENTO N.º 555 F. 111
2002
1

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

C E R T I F I C A:

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

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

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

Frankfurt a. M. 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Con \$45.00 de Ley E. S. N. N.



No - 0077

Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

10.10.1989 GMEP

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá No. 8506
12 ABR. 1989
MASE CONOTER
Cada el señor
Cartha Nino
cuya firma aparece en el presente
documento, siendo tal la persona
que funciona en el momento

Cartha Nino
ENCARGADO DE LEGACIONES ACUÑA
Legación de Colombia en Bogotá

NOTARIO PUBLICO
BOGOTA, BOGOTA, BOGOTA, BOGOTA
PROTOCOLA COINCIDE CON EL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 2 ENE. 2006
NOEL GARCIA BAUTISTA
NOTARIA (E)



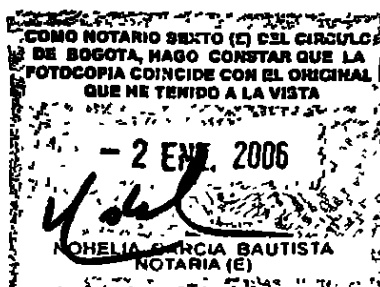
CON NOTARIO DE 1^{er} C^o DEL CIRCULO
DE 20^{ma} FAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONJUNTE CON EL ORIGINAL
QUE HE YU ADO A LA VISTA

- 2 ENE. 2006

[Signature]
NIBELIA GARCIA BAUTISTA
NOTARIA (E)

Die konsularische Legalisierung ist notwendig

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según los artículos 65 del C de P. C. y 480 del C de Co., si el poderdante es una sociedad, el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social, que quien confiere el poder es su representante y puede otorgar poder, seguidamente autenticar la firma de éste



TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

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

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

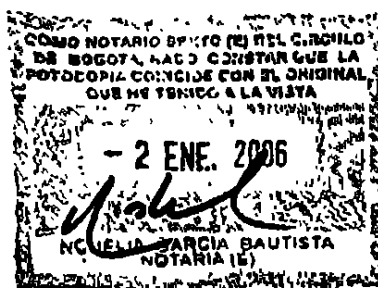
Protocolo notarial No. 1407/89

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

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

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona.

1



LUZ ARIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA DE INTERES OFICIAL
Resolución No. 599 Ministros

9

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

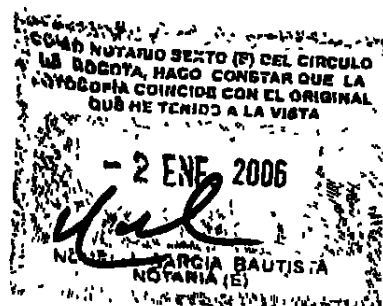
Notario de Ludwigshafen

Th. Walter

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

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

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



10.
El Presidente del Tribunal Regional

Fdp.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20,-- DM

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

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Luz Arriaga de Herber
Registación No 599 Minjusticia

COLOMBIA
BOGOTÁ, D.
MAYO, 1989

Luz Arriaga de Herber

05 AGO. 1999

SANTANA, D.C.

NOTARIO SEXTO (E) DE
BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE
ESTRUCURA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
2 ENE. 2006
NOVELLA CORTES BAUTISTA
NOTARIA (E)

NOTARIA D.E.L.A.
BOGOTÁ, D.C.
BOGOTÁ, D.C.
BOGOTÁ, D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá 28 ABR. 1965 No. 89013

HACE CONSTAR

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

Encargado

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

- 2 ENE. 2006

NOHELIA GARCIA BAUTISTA
 NOTARIA (E)

LEA LAS INSTRUCCIONES GENERALES
RECUERDE QUE TODOS LOS NÚM

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

881051599954



DECLARACION Y PAGO DEL
IMPUESTO D
TIMBR
NACIONAL

16 013 01 000045 1

16 013 01 000045 1

1 Administración de Impuestos de BOGOTA		Código 0,3	2 Teléfono 2120100
3 Documento de identificación (marque X) CC ☐ TI ☐ NIT ☒ No. 860041367 DV ☒		4 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 80 caracteres) CAVELIER ABOGADOS	
5 CC ☐ TI ☒ NIT ☐ No. 19' 301.629 DV ☐		6 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 80 caracteres) FORERO ROCHA JAIME	
7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4) Cra. 4a. No. 72-35		Municipio BOGOTA	Departamento CUNDINAMARCA
8 Relación e tipo(s) de documento(s), indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989 PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER COLO 0361-52-218-8			

Responsable del pago
Nombre CC No

1 VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	VP	750
2 Sanciones	VS	0
3 Intereses de mora	IM	0
4 TOTAL A PAGAR (Incluyendo 1, 2 y 3)	TP	750
5 Efecto ☒ Cheque ☐ No ☐		
6 Código Banco		

DEM-31-V-88

CONTRIBUYENTE

1 037

150.00

COMO NOTARIO BENITO (R) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 2 ENE 2006
HONORABLE GARCIA BAUTISTA
NOTARIA (E)

42

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL CAVE

TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLES CAVELEYES

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

Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

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

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

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

Acepto:

EMILIO FERRERO
NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, C.A. BOGOTAR QUE LA
T.P. FERRERO C.C. SE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
C.C. No. 438.019 de Usaquén

- 2 ENE. 2006

NEUTRA GARCIA BAUTISTA
NOTARIA (E)

2e-780-2

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro del Decreto 2282 de 1989)

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

quien exhibio la cedula de ciudadanía número 429911
expedida en 11/12/94 y la tarjeta profesional
número 21.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a D.D. MUÑOZ (MARTINEZ)
y declaro que la firma que aparece en este es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro del Decreto 2282 de 1989)

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

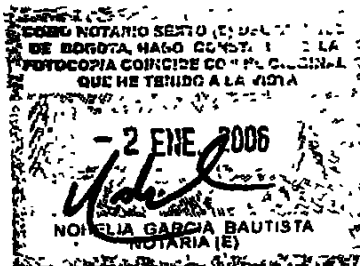
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 2872224
expedida en 27 y la tarjeta profesional
número 832 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a División Nuevos Creadores
y declaro que la firma que aparece en este es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

Anja Schwögl ✓
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr ✓
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller ✓
Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
Thomas Grote ✓
Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
Wassilios Grammenos ✓
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Jordi Tormo i Blasco ✓
Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach
Germany
Citizen of Spain
Andreas Gypser ✓
B 4, 4, 68159 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Joachim Rheinheimer ✓
Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
Carsten Blettner ✓
Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Peter Schafer ✓
Romerstr. 1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

Frank Schieweck /
 Lindenweg 4, 67258 Heßheim
 Germany
 Citizen of Germany
 Oliver Wagner /
 Im Meisental 50, 67433 Neustadt
 Germany
 Citizen of Germany
 Reinhard Stierl /
 Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
 Germany
 Citizen of Germany
 Ulrich Schoßl /
 Erlenstr. 8, 68782 Bruhl
 Germany
 Citizen of Germany
 Siegfried Strathmann /
 Donnersbergstr.9, 67117 Lumburgerhof
 Germany
 Citizen of Germany
 Maria Scherer /
 Hermann-Jurgens-Str.30, 76829 Godramstein
 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- substituidas

2-substituted pyrimidine

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

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

BASF Aktiengesellschaft

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Alamania

Germany

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Alamania

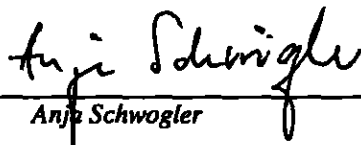
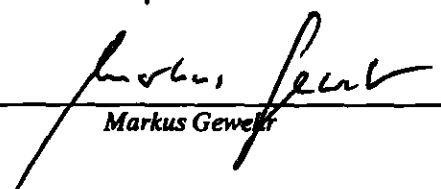
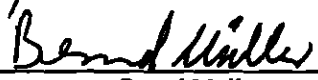
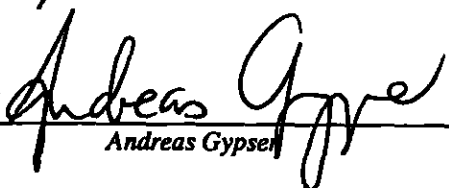
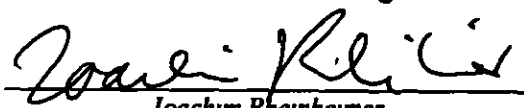
67056 Ludwigshafen, Germany

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.

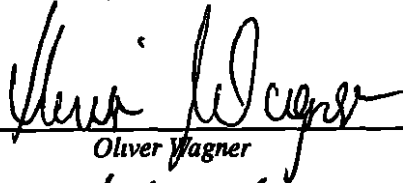
Dado y firmado hoy Given and signed this **19. Juli 2004**

Firma Signature


Anja Schwogler
Markus Gewelt
Bernd Müller
Thomas Gräbe
Wassilios Grammenos
Jordi Tormo i Blasco
Andreas Gypser
Joachim Rheinheimer
Carsten Blettner
Peter Schäfer



Frank Schieweck



Oliver Wagner



Reinhard Stierl



Ulrich Schoft



Siegfried Strathmann



Maria Scherer

Urk.R.Nr. 1636/2004

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

1. Mrs. Anja **Schwögler**, residing at Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
2. Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
3. Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
4. Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
6. Mr. Jordi **Tormo i Blasco**, residing at Carl-Benz-Straße 10-3, 69514 Laudenbach, Germany, personally known to me,
7. Mr. Andreas **Gypser**, residing at B 4, 4, 68159 Mannheim, Germany, personally known to me,
8. Mr. Joachim **Rheinheimer**, residing at Merziger Straße 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
9. Mr. Carsten **Blettner**, residing at Richard-Wagner-Straße 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
10. Mr. Peter **Schäfer**, residing at Romerstraße 1, 67308 Ottersheim, Germany, personally known to me,
11. Mr. Frank **Schieweck**, residing at Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Germany, personally known to me,
12. Mr. Oliver **Wagner**, residing at Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Germany, personally known to me,

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

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 19th 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 Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 922-995/04

9. Siegel/Stempel: 10. Unterschrift



Werner Tholey
.....
(Werner Tholey)

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUO)

NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

A los días del mes de de 200

On this 19th day of July 2004

ante mí, Notario Público de

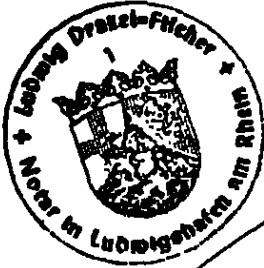
compareció(eron) personalmente

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

Anja Schwögl, Markus Gewehr,
Bernd Müller, Thomas Grote,
Wassilios Grammenos, Jordi Tormo
i Blasco, Andreas Gypser, Joachim
Rheinheimer, Carsten Blettner,
Peter Schäfer, Frank Schieweck,
Oliver Wagner, Reinhard Stierl,
Ulrich Schöfl, Siegfried Strathmann
and Maria Scherer

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

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



Notario Público Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

A P O S T I L L E

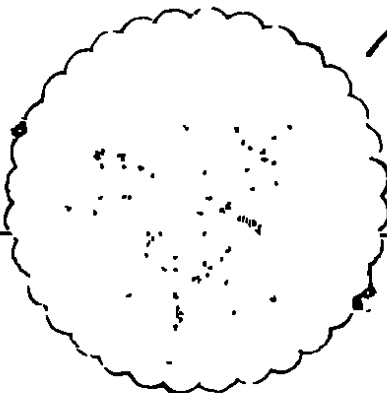
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

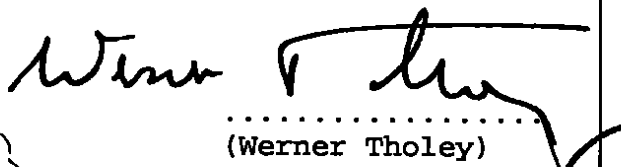
1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
Draxel-Fischer
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Ludwig Draxel-Fischer
in Ludwigshafen am Rhein

Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 9. August 2004
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 922-995/04

9. Siegel/Stempel: 10. Unterschrift




.....
(Werner Tholey)

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

TRADUCCION OFICIAL No. 11097

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

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

Anja Schwöglér
Heinrich-Lanz-Str 3, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Markus Gewehr
Goethestr 21, 56288 Kastellaun
Alemania
Ciudadano de Alemania
Bernd Müller
Stöckingerstr. 7, 67227 Frankenthal
Alemania
Ciudadano de Alemania
Thomas Grote
Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim
Alemania

Ciudadano de Alemania
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str 13, 67071 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Grecia
Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudendach
Alemania
Ciudadano de España
Andreas Gypser
B 4, 4, 68159 Mannheim,
Alemania
Ciudadano de Alemania
Joachim Rheinheimer
Merziger Str 24; 67063 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Alemania
Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Peter Schäfer

LUZ ARIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No 599 Minjusticia

Römerstr I, 67308 Ottersheim
 Alemania
 Ciudadano de Alemania
 Frank Schieweck Lindenweg 4, 67258 Heßheim
 Alemania
 Ciudadano de Alemania
 Oliver Wagner
 Im Meisental 50, 67433 Neustadt
 Alemania
 Ciudadano de Alemania
Reinhard Stierl
 Johanstr. 8, 67251 Freinsheim
 Alemania
 Ciudadano de Alemania
 Ulrich Schöfl
 Erlenstr. 8, 68782 Bruhl
 Alemania
 Ciudadano de Alemania
 Siegfried Strahmann
 Donnersbergstr 9, 67117 Limburgerhof
 Alemania
 Ciudadano de Alemania
 Maria Scherer
 Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein
 Alemania
 Ciudadano de Alemania

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

Pirimidinas 2-sustituidas

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

Autenticación notarial en inglés de las dieciséis firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio 2004,
 Fdo.: firma ilegible, sello notarial en tinta. Valor: 5.112,92 Euros

LUZ ABRAAGA DE HERRERA
 TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
 Resolución No 599 Minjusticia

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer

3. Actuando en calidad de notario público

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

Certificado

- 5 en Frankenthal (Pfalz)

6. el 8 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 €

Autenticación notarial en inglés de las dieciseis firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio 2004, bajo el No. 1636/2004. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5 112,92 Euros

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

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

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

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRM(A)S

Luz Prieta Haber

COINCIDE CON LA FIRMA REGISTRADA POR
(EL/LOS) EN ESTA NOTARIA

0-2-2006

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 JUN 4 P-1213

JEF. DE REGISTRO
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

NOTARIA SEXTO
NOHELA GARCIA
BAUTISTA
Notario Sexto Encargado

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

392-17
Luz Prieta
CITAFINHA FAVELLE
DOLLEMEHO DESENPEHA
LAS FUNCIONES HABITUALES

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 8 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, 28 de diciembre de 2005

C 3207

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

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

Luz Prieta Herber

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL(LOS) EN ESTA NOTARIA SANTAFE DE BOGOTA

04ENE 2005

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 JAN 4 A 11:59

Jefe de Legitimaciones
SANTAFE DE BOGOTA D.C.



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

99223 n
Luz Prieta Herber
COPIA PARA REGISTRO
DOCUMENTO DE SORTEO
LAS FIRMAS INICIADAS

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 01.03/06a realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia, registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (INDIVIDUO) del 19 de julio de 2004 por medio de la cual se autentican las firmas de Anja Schwögler, Markus Gewehr, Bernd Müller, Thomas Grote, Wassilios Grammenos, Jordi Tormo i Blasco, Andreas Gypser, Joachim Rheinheimer, Carsten Blettner, Peter Schäfer, Frank Schieweck, Oliver Wagner, Reinhard Stierl, Ulrich Schöfl, Siegfried Strathmann y Maria Scherer en el anterior documento así como su capacidad legal otorgarlo.

Firma Ilegible

Sello Notarial

(Anexo)

Sello de Apostille expedido en la República Federal de Alemania y certificada el 9 de Agosto de 2004 con el Nr. 91 Eb - 922-995/04 firmado por Werner Tholey.

Urk.R. Nr. 1636/2004

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. La señora Anja Schwögler, domiciliada en Heinrich-Lanz-Str.3, 68165 Mannheim, Alemania, a quién conozco personalmente,
2. El señor Markus Gewehr, domiciliado en Goethestraße 21, 56288 Kastellaun, Alemania, a quién conozco personalmente,

Ludwigshafen/Rhine, hoy 19 de Julio de 2004

Sello de
Oblea

Firma Ilegible
Notario Público

(Anexo)

Sello de Apostille expedido en la República Federal de Alemania y certificada el 9 de Agosto de 2004 con el Nr. 91 Eb - 922-995/04 firmado por Werner Tholey.

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

DVZ//ID-007403/WPCL002G/COLO 00361-841-074-4


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

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA
 BOGOTA. HAGO CONSTATAR QUE LA(S) FIRMA(S),
Diego Felipe Vargas
 COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
 EL GOBIERNO EN ESTA NOTARIA
 SANTA FE DE BOGOTA
 07 JUN 2006



NO SE ASUME
 RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
 2006 JUN -14 A 11:59
Diego
 JEFE DE LEGISLACIONES
 SANTA FE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
 EXTERIORES
Diego 3922
 CUYA FIRMA APARECE EN EL
 DOCUMENTO DESEMPLEA
 LAS FUNCIONES DEL CIRCULO

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
10. Februar 2005 (10.02.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/012261 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 239/42
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/007877
- (22) Internationales Anmeldedatum:
15 Juli 2004 (15 07.2004)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
103 33 857.8 24. Juli 2003 (24 07 2003) DE
103 57 714 9 9. Dezember 2003 (09.12.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE], 67056 Ludwigshafen (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHWÖGLER, Anja [DE/DE], Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE) GEWEHR, Markus [DE/DE], Goethestr. 21, 56288 Kastellaun (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE], Stockingerstrasse 7, 67227 Frankenthal (DE) GROTE, Thomas [DE/DE], Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE) GRAMMIGNOS, Wasilios [GR/DE], Alexander-Fleming-Strasse 13, 67071 Ludwigshafen (DE) TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE], Carl-Benz-Strasse 10-3, 69514 Laudenbach (DE) GYPSEK, Andreas [DE/DE], 04, 4, 68159 Mannheim (DE) RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE], Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen (DE). BLETTNER, Carsten [DE/DE], Richard-Wagner-Strasse 48, 68165 Mannheim (DE) SCHÄFER, Peter [DE/DE], Romerstrasse 1, 67308 Ottersheim (DE) SCHIEWECK,

Frank [DE/DE], Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE], Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE) STIERL, Reinhard [DE/DE], Jahnstrasse 8, 67251 Freinsheim (DE) SCHÖFL, Ulrich [DE/DE], Erlenstrasse 8, 68782 Brühl (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE], Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE) SCHERER, Maria [DE/DE], Hermann-Jurgens-Strasse 30, 76829 Goldramstein (DE)

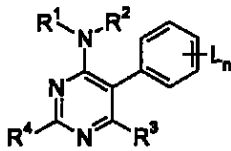
- (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT, 67056 Ludwigshafen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

Veröffentlicht:
— mit internationalem Recherchenbericht

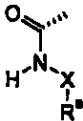
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 2-SUBSTITUTED PYRIMIDINES

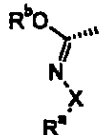
(54) Bezeichnung: 2-SUBSTITUIERTE PYRIMIDINE



(I)



(II)



(III)

(57) Abstract: The invention relates to 2-substituted pyrimidines of formula (I), wherein the index n, the substituents R¹ to R³, and L are defined as indicated in the description while R⁴ corresponds to one of formulas (II) or (III), wherein R⁴, X, and R^b are defined as indicated in the description Also disclosed are methods for the production thereof, pesticides containing the same, and the use thereof as pesticides

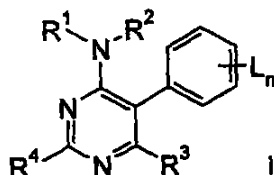
(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft 2-Substituierte Pyrimidine der Formel (I) in der der Index n und die Substituenten R¹ bis R³ sowie L wie in der Beschreibung definiert sind und R⁴ einer der Formeln entspricht, in denen R⁴, X und R^b wie in der Beschreibung definiert sind, sowie Verfahren zu deren Herstellung, diese enthaltende pestizide Mittel und deren Verwendung als Pestizide.

WO 2005/012261 A1

2-Substituierte Pyrimidine

Beschreibung

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



in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben.

10 n eine ganze Zahl von 1 bis 5;

15 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_2 - C_8 -Alkenyloxy, C_2 - C_8 -Alkynyloxy, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_4 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyloxy, C_4 - C_8 -Cycloalkenyloxy, Nitro, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ oder $S(=O)_m-N(A')A$,

m 0, 1 oder 2,

20 A , A' , A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Nitro, Cyanato, Cyano oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

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

R^u Cyano, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_2 - C_8 -Alkenyloxy, C_2 - C_8 -Alkynyloxy, C_4 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyloxy, C_4 - C_8 -Cycloalkenyloxy

$-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ oder $S(=O)_m-N(A')A$;

5 R^1, R^2 unabhängig voneinander C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Halogenycycloalkyl, wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^1 und R^2 ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R^v tragen können.

10 R^v Cyano, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_4-C_6 -Cycloalkenyl, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_6 -Alkenyloxy, C_2-C_6 -Alkinyloxy, C_3-C_6 -Cycloalkyloxy, C_4-C_6 -Cycloalkenyloxy, C_1-C_6 -Alkylthio, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ oder $S(=O)_m-N(A')A$ oder Phenyl, wobei der Phenylteil ein bis
15 drei Reste ausgewählt aus der Gruppe: 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, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$ tragen kann;

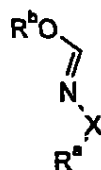
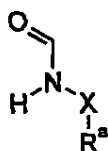
20 R^2 kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether $-(O-)$, Carbonyl $-(C=O)-$, Thio $-(S-)$, Sulfoxyl $-(S(=O)-)$ oder Sulfenyl $-(SO_2-)$ oder eine weitere Amino $-(N(R^a)-)$ Gruppe, wobei R^a Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl und Oxy- C_1-C_3 -alkylenoxy enthalten kann;

30 R^3 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_4 -Alkoxy, C_3-C_4 -Alkenyloxy, C_3-C_4 -Alkinyloxy, C_1-C_6 -Alkylthio, Di- $(C_1-C_6$ -alkyl)amino oder C_1-C_6 -Alkylamino, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von R^3 durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_2 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxy-carbonyl substituiert sein können,

35

R^4 einer der Formeln



entspricht, in denen

- 5 X eine direkte Bindung, $-(C=O)-$, $-(C=O)-NH-$, $-(C=O)-O-$, $-O-$, $-NR^c-$, $-CH_2-O-$, $(C=O)-$, $-C=C-(C=O)-$, wobei das jeweils linke Atom des Brückenglieds an das Stickstoffatom gebunden ist,
- 10 R^a Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder Benzyl;
- R^b Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl oder C_2-C_6 -Alkynyl;
- 15 R^c Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, Benzyl oder C_1-C_6 -Acyl
bedeuten,
wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Res-
tedefinitionen von R^a , R^b und/oder R^c ihrerseits eine bis vier Gruppen R^w
tragen können:
- 20 R^w Halogen, Cyano, OR^x , NHR^x , SR^x , C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_1-C_6 -Alkoxy, 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, wobei
- R^x Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder Benzyl
bedeutet.

25

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, 2-Pyrimidine enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze.

30

Aus WO-A 01/96314 sind fungizide Pyrimidine, die in 2-Stellung einen Cyanamino-substituenten tragen, bekannt. Weiterhin sind aus WO-A 03/43993 fungizide 2-Pyrimidyl-N-methoxyamidine bekannt.

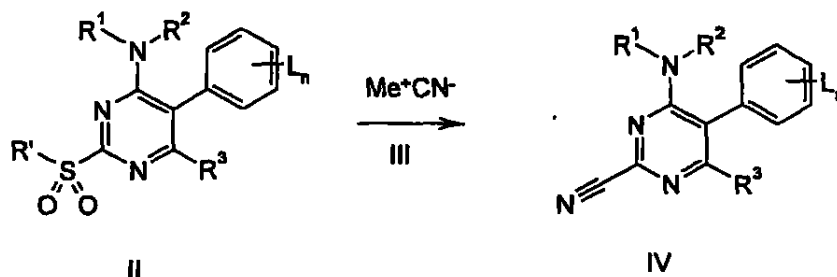
35 Die Wirkung der o.g. Pyrimidine ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden

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

40

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden.

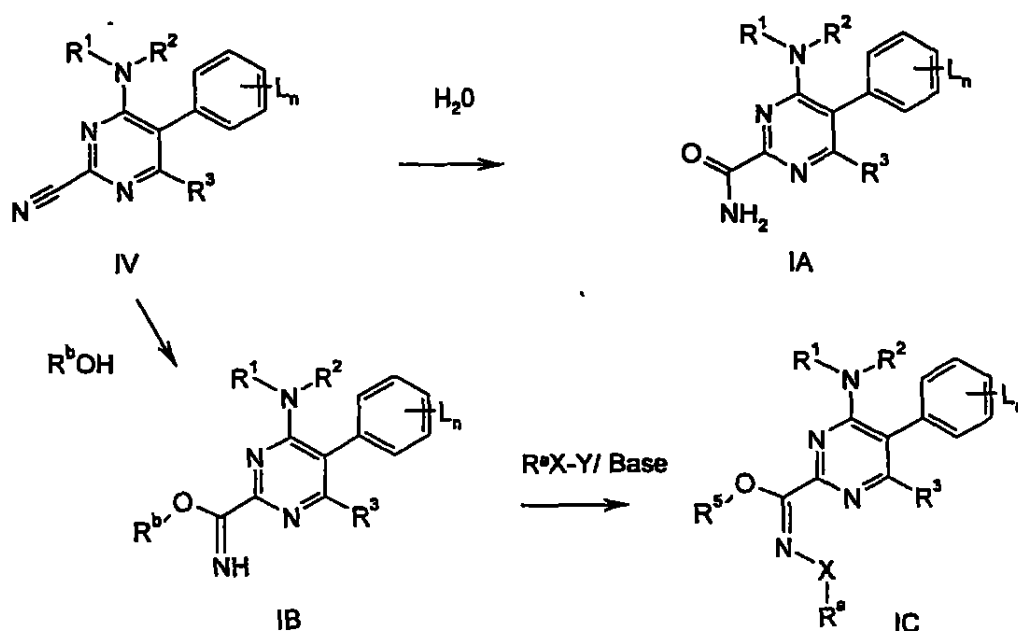
- 1) Beispielsweise kann von den Sulfonen der Formel II ausgegangen werden, deren Herstellung in WO-A 02/074753 oder DE 10156279.9 detailliert beschrieben ist. Durch Umsetzung der Sulfone II mit Metallcyaniden III (Me^+CN^-) werden die Nitrile IV gewonnen. Unter Metallcyaniden sind in erster Linie Alkali- oder Erdalkalicyanide oder auch kovalente Cyanide wie Zinntetracyanid zu verstehen.



- 10 Der Austausch der Sulfonatgruppe gegen die Nitrilgruppe erfolgt nach literaturbekannten Methoden wie sie beispielsweise in WO-A 03/043993 beschrieben sind.

Die weitere Synthese kann wie in Schema 1 dargestellt erfolgen:

- 15 Schema 1:



- Die Nitrilverbindung IV kann unter sauren oder vorzugsweise basischen Bedingungen zum Amid IA hydrolysiert werden. Die Hydrolyse erfolgt beispielsweise unter den von Katritzky et al in Synthesis 1989, S 949-950 beschriebenen Bedingungen (Wasserstoffperoxid, Base, polares aprotisches Lösungsmittel). In Comprehensive Organic

Chemistry, Vol 2, Sutherland, I.O Pergamon Press, Oxford, 1979, S. 964 sind Hydrolysen von Nitrilen zu Amiden unter sauren Bedingungen beschrieben.

Alternativ hierzu kann das Pinneraddukt, das sich durch Anlagerung von in der Regel Salzsäure an das Nitril IV bildet, mit einem Alkohol der Formel R^bOH , wobei R^b die zuvor genannte Bedeutung besitzt, zum Iminoether der Formel IB umgesetzt werden. Die Alkylierung mit R^aX-Y , wobei R^a und das Brückenglied X die eingangs erwähnte Bedeutung hat und Y für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, Sulfat oder Sulfonat steht, liefert Verbindungen des Typs IC.

10

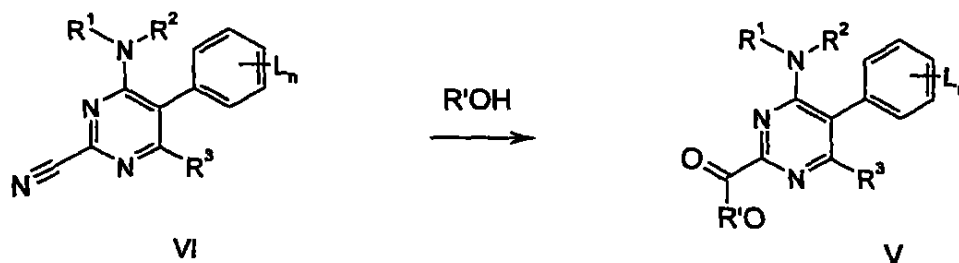
Die Alkylierung mit R^a-Y kann ausgehend von Verbindung IB oder dem Nitril IV auch mit Meerwein Salzen der Formel $(R^a)_3OBF_4$ analog den in Synth. Commun., 1983, 13, S. 753 oder Helv. Chim. Acta, 1986, 69, S. 1224 aufgeführten Vorschriften durchgeführt werden. Man gelangt zu Verbindungen I, wobei X für eine direkte Bindung steht

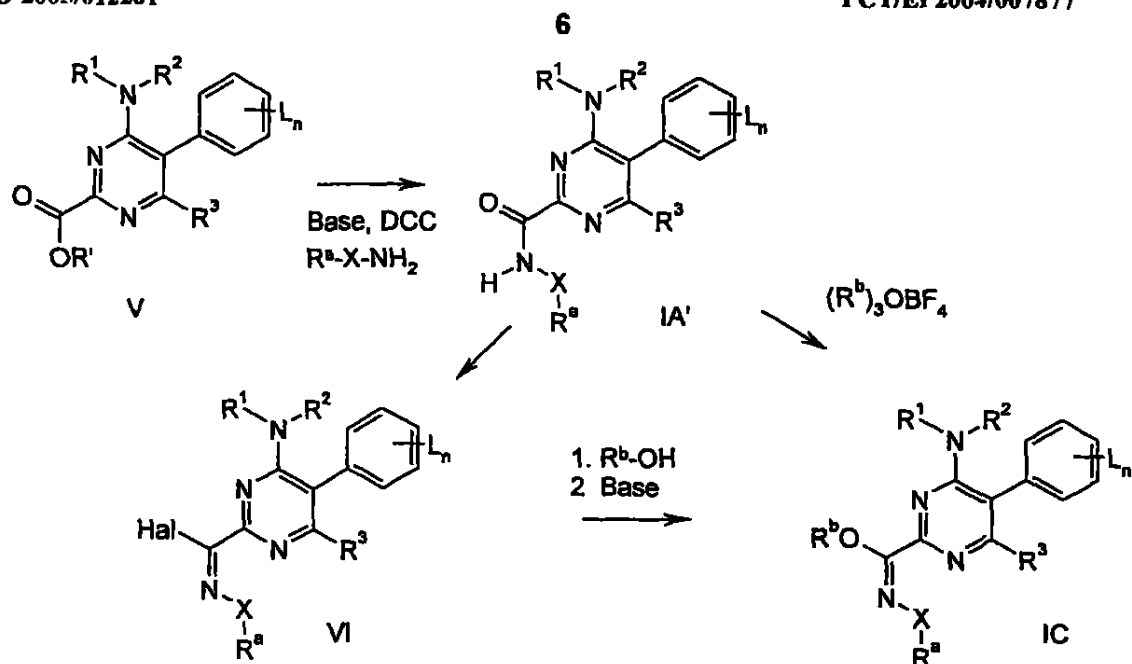
15

Eine alternative Synthese der erfindungsgemäßen Verbindungen IA ist in Schema 2 aufgeführt.

Schema 2:

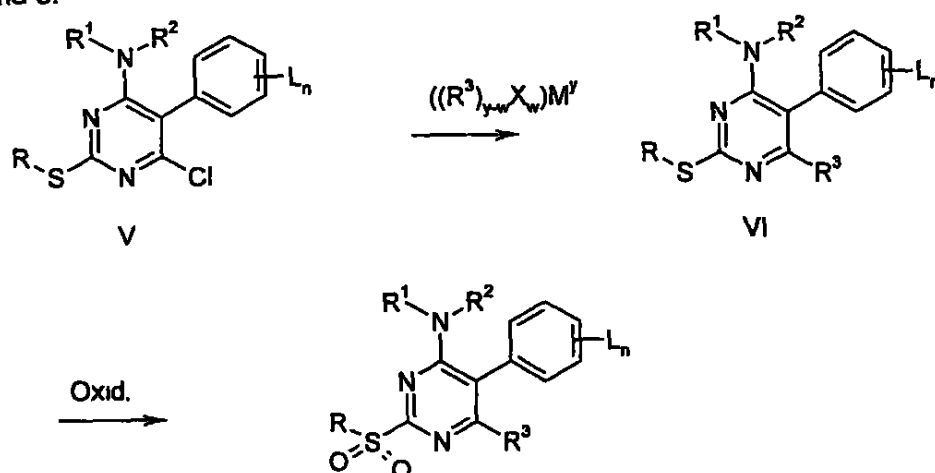
20





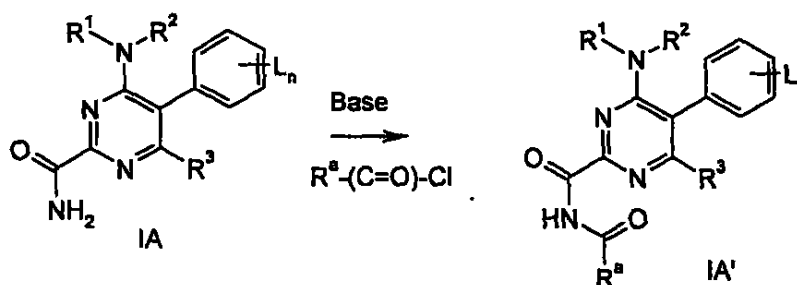
- Die in Schema 2 aufgeführte Synthese der Verbindungen IA' und IC geht wiederum von Nitril IV aus. Die Nitrilbildung IV kann unter vorzugsweise sauren Bedingungen in Gegenwart von Alkoholen der Formel R'OH, wobei R' für C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl partiell oder vollständig halogeniert sein können und eine bis drei Gruppen R' tragen können, steht, hergestellt werden. Die Umsetzung von V mit Aminen zu den Amiden IA' kann wie in Org.Lett., 2001, Vol 3, S. 1053-56 oder in J.Org.Chem, 2000, Vol 85, S. 8415-20 beschrieben, durchgeführt werden. Die anschließende Umsetzung mit Meerwein Salzen der Formel (R^b)₃OBF₄ analog den in Synth. Commun., 1983, 13, S. 753 oder Helv. Chim.Acta, 1986, 69, S. 1224 aufgeführten Vorschriften führt zu den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel IC. Die Iminhalogenide der Formel VI, wobei Hal für Halogen und insbesondere Chlor und Brom steht, sind analog Synthesis, 1991, Vol 9, S. 750-752 zugänglich. In einer Appel Reaktion werden beispielsweise mit Tetra-bromkohlenstoff und Triphenylphosphin die entsprechenden Bromverbindungen hergestellt. Letztere lässt sich schließlich mit Alkoholen der Formel R^bOH und Basen zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IC umsetzen.
- Der Rest R³ (insbesondere Alkyl) in 6-Position am Pyrimidinring kann durch Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse eingeführt werden. In manchen Fällen kann es ratsam sein die Reihenfolge umzudrehen und den Substituenten R³ vor dem Substituenten NR¹R² einzuführen.

Schema 3.



- In Formel $((R^3)_yX_w)M^y$ steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn, Mg, Cu oder Sn, X steht für Chlor, Brom, Iod oder Hydroxy, R^3 bedeutet bevorzugt C_1 - C_4 -Alkyl und w steht für eine Zahl von 0 bis 3. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990), J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992)

Der Substituent R^a in Formel IA' kann auch wie in Schema 4 gezeigt eingeführt werden



- Hierbei werden die Verbindungen der Formel IA mit Hilfe starker Basen zunächst ins Anion übergeführt und anschließend mit entsprechenden Säurechloriden zu IA' umgesetzt (s. J. Chem. Soc., Perkin Trans I, 1995, S. 3043). Man gelangt so zu Verbindungen, in denen X für ein $C=O$ -Brückenglied steht. Als Basen für die Herstellung des Anions eignen sich beispielsweise Natriumamid und Natriumhydrid.

Die obengenannten Angaben beziehen sich insbesondere auf die Herstellung von Verbindungen, in denen R^3 eine Alkylgruppe darstellt. Sofern R^3 eine Cyangruppe oder einen Alkoxy-substituenten bedeutet, kann der Rest R^3 durch Umsetzung mit Alkalimetallcyaniden bzw. Alkalimetallalkoholaten eingeführt werden.

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

5

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod,

Alkyl sowie die Alkylteile von beispielsweise Alkoxy, Alkylamino, Alkoxy-carbo-
nyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 o-
10 der 8 Kohlenstoffatomen, z B. C₁-C₈-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Bu-
tyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-
Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-
Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-
Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-
15 Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-
Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-
methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 8 Kohlenstoffato-
20 men (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die
Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können,
z.B C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl,
Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-
difluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl,
25 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl,
2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis
4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position,
30 z B C₂-C₈-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-
Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-
Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-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-
35 Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-
1propenyl, 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-
40 pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-

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

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

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_8 -Alkynyl wie Ethynyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C_3 - C_6 -Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl;

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

- **5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl,** enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-

- Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 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-
 5 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-
 10 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-
 15 2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl,
 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-
 Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-
 Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-
 Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-
 20 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-
 25 Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-
 triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;
- **5-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei
 Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgrup-
 30 pen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis
 drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder ent-
 halten können, z.B. 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-
 35 Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-
 yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-
 3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl,
- **6-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome:
 40 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein

bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

- 5 - Ringsystem, das gegebenenfalls von R^1 und R^2 bzw. von A und A' zusammen mit dem Stickstoff, an den sie gebunden sind, aufgespannt wird: Pyrrolidin, Morpholin, Pipendin oder Tetrahydropyrazol

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

Im folgenden werden die Ausführungsformen der Erfindung genauer beschrieben.

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

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

20 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für in α -Stellung verzweigtes C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl steht.

25 Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für C_1 - C_4 -Halogenalkyl und R^2 für Wasserstoff stehen.

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

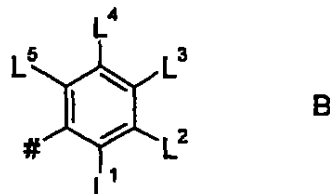
Insbesondere bevorzugt sind Gruppen NR^1R^2 wie – insbesondere in α -Stellung – methylierte Pyrrolidine oder Piperidine. Weiterhin ist 4-Methylpipendin bevorzugt.

35 Insbesondere werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die Substituenten L^1 bis L^5 die folgende Bedeutung haben:

L Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$,

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl

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



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

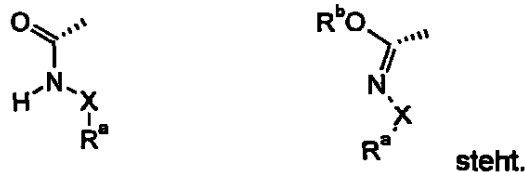
- L¹ Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃,
 10 L², L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, CH₃ oder Fluor;
 L³ Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, CH₃, SCH₃, OCH₃, SO₂CH₃, CO-NH₂, CO-NHCH₃, CO-NHC₂H₅, CO-N(CH₃)₂, NH-C(=O)CH₃, N(CH₃)-C(=O)CH₃ oder COOCH₃ und
 L⁵ Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH₃ bedeuten.

15 Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen R³ C₁-C₄-Alkyl bedeutet, das durch Halogen substituiert sein kann.

20 Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R³ für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy steht.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ Methyl, Cyano, Methoxy oder insbesondere Chlor bedeutet.

25 Geeignet im Hinblick auf ihre fungizide Wirkung sind Pyrimidine der Formel I, in der R⁴ für



Weiterhin sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R⁴ für



30 steht

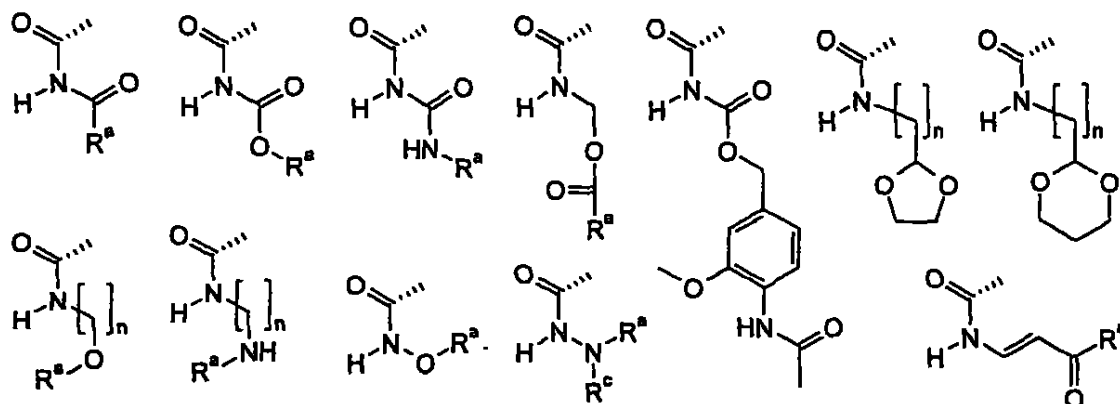
Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R⁴ für



steht

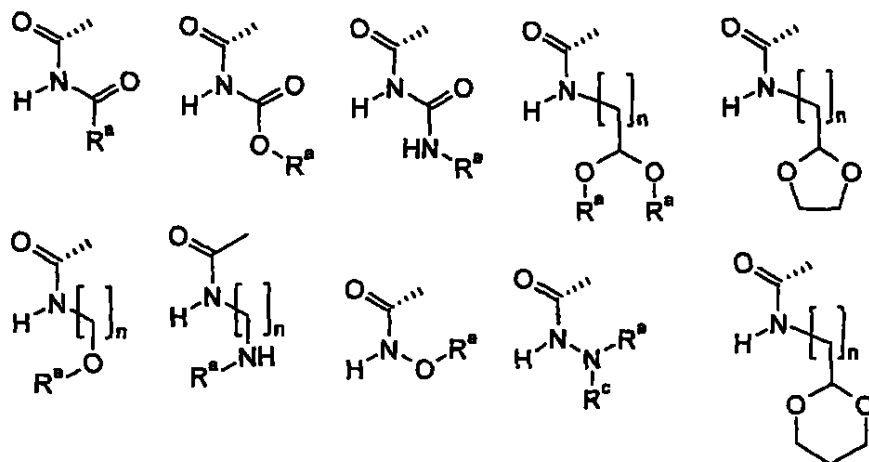
5

Schließlich kann R⁴ bevorzugt die folgenden Bedeutungen haben, die auch als prodrug-Restedefinitionen aufgefasst werden können (s. Medicinal Research Reviews 2003, 23, 763 – 793, oder J. of Pharmaceutical Sciences 1997, 86, 765-767):



10 Der Index n in den Alkenylenresten der obigen Formeln steht für eine ganze Zahl 1 bis 3

Insbesondere bevorzugt sind die Restedefinitionen R⁴:



Das Brückenglied X steht bevorzugt für eine direkte Bindung und für -(C=O)-.

15

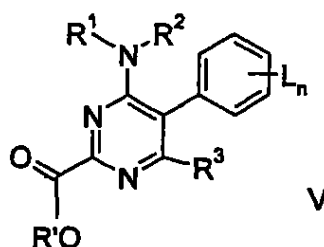
Der Substituent R^a steht vorzugsweise für Wasserstoff, Methyl, Benzyl, Trifluormethyl, Allyl, Propargyl oder Methoxymethyl und besonders bevorzugt für Wasserstoff.

Der Substituent R^b bedeutet bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl und insbesondere bevorzugt: Methyl, Allyl oder Propargyl

20

Der Substituent R^c bedeutet bevorzugt Wasserstoff oder Methyl.

Die Ester der Formel V



5

sind sowohl interessante Zwischenprodukte, als auch exzellente fungizide Wirkstoffe.

Die zuvor genannten Bevorzugungen der Definitionen von L_n , R^1 bis R^3 gelten im gleichen Sinne auf für die Ester der Formel V.

10

R' steht insbesondere für einen C_1 - C_6 -Alkylrest, insbesondere bevorzugt für einen Isopropylrest

15

R' kann jedoch auch die Bedeutungen Allyl, Propargyl, Benzyl, Aminoalkyl, Hydroxyalkyl, Alkoxyalkyl oder Halogenalkyl

20

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

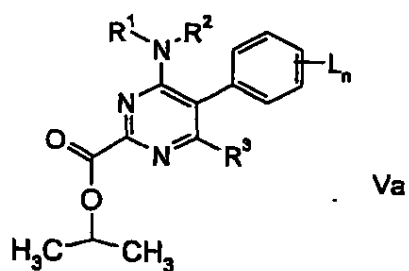
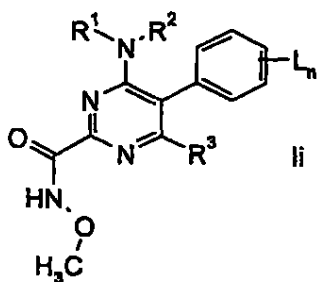
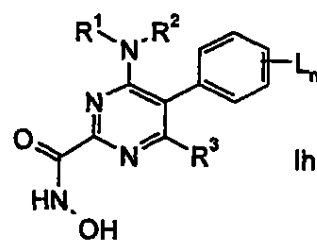
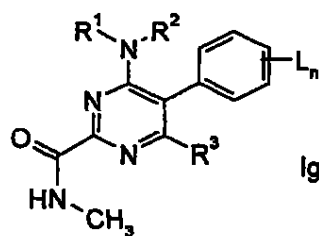
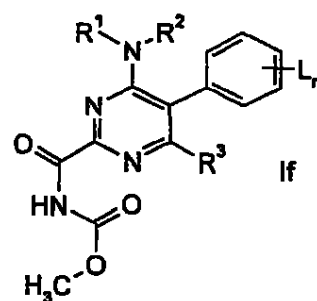
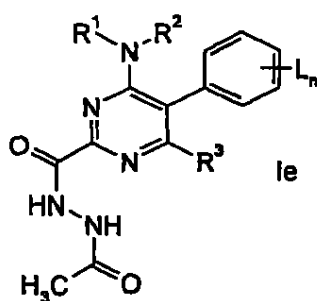
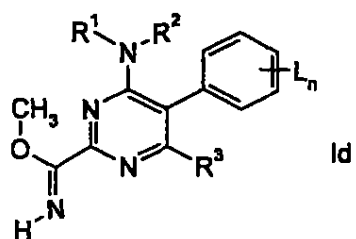
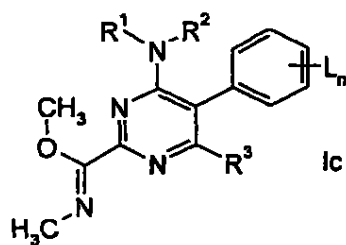
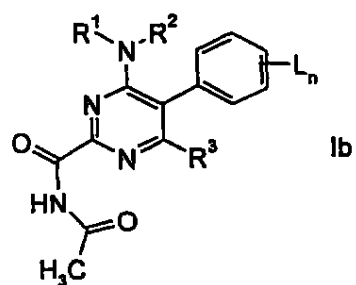
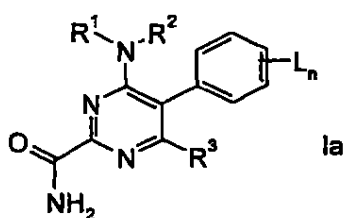


Tabelle 1

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

Tabelle 2

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

Tabelle 3

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

Tabelle 4

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

Tabelle 5

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

Tabelle 6

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

Tabelle 7

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

Tabelle 8

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

5 Tabelle 9

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

10 Tabelle 10

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

15 Tabelle 11

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

20 Tabelle 12

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

25 Tabelle 13

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

30 Tabelle 14

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

35 Tabelle 15

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

40 Tabelle 16

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

5 Tabelle 17

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

10 Tabelle 18

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

15 Tabelle 19

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

20 Tabelle 20

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

25 Tabelle 21

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

30 Tabelle 22

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

35 Tabelle 23

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

Tabelle 24

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

5 Tabelle A entspricht

Tabelle 25

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,6-Difluor-4-cyano, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 26

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methyl, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

15 belle A entspricht

Tabelle 27

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer

20 Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 28

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

25 Tabelle A entspricht

Tabelle 29

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

30 belle A entspricht

Tabelle 30

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Chlor,4-methoxycarbonyl, R^3 Methyl bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer

35 Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 31

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

40 belle A entspricht

Tabelle 32

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

Tabelle 33

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

Tabelle 34

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

Tabelle 35

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

Tabelle 36

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

Tabelle 37

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

Tabelle 38

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

Tabelle 39

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

Tabelle 40

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

5

Tabelle 41

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

10

Tabelle 42

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

15

Tabelle 43

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

20

Tabelle 44

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

25

Tabelle 45

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

30

Tabelle 46

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

35

Tabelle 47

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

40

Tabelle 48

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

Tabelle 49

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

Tabelle 50

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

Tabelle 51

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

Tabelle 52

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

Tabelle 53

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

Tabelle 54

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

Tabelle 55

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

Tabelle 56

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

5

Tabelle 57

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

10

Tabelle 58

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

15

Tabelle 59

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

20

Tabelle 60

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

25

Tabelle 61

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

30

Tabelle 62

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

35

Tabelle 63

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

40

Tabelle 64

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

Tabelle 65

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

Tabelle 66

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

Tabelle 67

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

Tabelle 68

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

Tabelle 69

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

Tabelle 70

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

Tabelle 71

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

Tabelle 72

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

5 der Tabelle A entspricht

Tabelle 73

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Chlor,4-Methoxy, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 74

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

15 belle A entspricht

Tabelle 75

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

20 der Tabelle A entspricht

Tabelle 76

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

25 A entspricht

Tabelle 77

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

30 A entspricht

Tabelle 78

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

35 belle A entspricht

Tabelle 79

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

40 belle A entspricht

Tabelle 80

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

5 entspricht

Tabelle 81

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

10 A entspricht

Tabelle 82

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

15 A entspricht

Tabelle 83

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

20 A entspricht

Tabelle 84

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

25 belle A entspricht

Tabelle 85

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

30 der Tabelle A entspricht

Tabelle 86

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

35 der Tabelle A entspricht

Tabelle 87

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

40 A entspricht

Tabelle 88

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

5 belle A entspricht

Tabelle 89

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Fluor, 5-methyl, R^3 Chlor bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 90

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

15 spricht

Tabelle 91

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

20 belle A entspricht

Tabelle 92

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

25 entspricht

Tabelle 93

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

30 entspricht

Tabelle 94

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

35 Tabelle A entspricht

Tabelle 95

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

40 entspricht

Tabelle 96

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

Tabelle 97

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

Tabelle 98

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

Tabelle 99

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

Tabelle 100

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

Tabelle 101

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

Tabelle 102

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

Tabelle 103

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

Tabelle 104

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

5

Tabelle 105

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

10

Tabelle 106

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

15

Tabelle 107

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

20

Tabelle 108

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

25

Tabelle 109

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

30

Tabelle 110

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

35

Tabelle 111

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

40

Tabelle 112

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Fluor-4-methyl, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

5 Tabelle A entspricht

Tabelle 113

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

10 entspricht

Tabelle 114

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,4,6-Trimethyl, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

15 Tabelle A entspricht

Tabelle 115

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,6-Difluor-4-cyano, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

20 Tabelle A entspricht

Tabelle 116

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,6-Difluor-4-methyl, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

25 Tabelle A entspricht

Tabelle 117

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2,6-Difluor-4-Methoxycarbonyl, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer

30 Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 118

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

35 Tabelle A entspricht

Tabelle 119

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

40 Tabelle A entspricht

AA
44

Tabelle 120

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Chlor, 4-methoxycarbonyl, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer

5 Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 121

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

10 Tabelle A entspricht

Tabelle 122

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Chlor, 4-Cyan, R^3 Methoxy bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

15 belle A entspricht

Tabelle 123

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

20 Tabelle A entspricht

Tabelle 124

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

25 Tabelle A entspricht

Tabelle 125

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

30 entspricht

Tabelle 126

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

35 belle A entspricht

Tabelle 127

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

40 belle A entspricht

Tabelle 128

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

Tabelle 129

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

Tabelle 130

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

Tabelle 131

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

Tabelle 132

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

Tabelle 133

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

Tabelle 134

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

Tabelle 135

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

Tabelle 136

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

5

Tabelle 137

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

10

Tabelle 138

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

15

Tabelle 139

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

20

Tabelle 140

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

25

Tabelle 141

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

30

Tabelle 142

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

35

Tabelle 143

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

40

Tabelle 144

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

Tabelle 145

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

Tabelle 146

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

Tabelle 147

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

Tabelle 148

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

Tabelle 149

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

Tabelle 150

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

Tabelle 151

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

Tabelle 152

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

5

Tabelle 153

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

10

Tabelle 154

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

15

Tabelle 155

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

20

Tabelle 156

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

25

Tabelle 157

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

30

Tabelle 158

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

35

Tabelle 159

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

40

Tabelle 160

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

Tabelle 161

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

Tabelle 162

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

Tabelle 163

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

Tabelle 164

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

Tabelle 165

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

Tabelle 166

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

Tabelle 167

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

Tabelle 168

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

5 Tabelle A entspricht

Tabelle 169

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Fluor,3-methyl, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 170

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

15 entspricht

Tabelle 171

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

20 le A entspricht

Tabelle 172

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

25 le A entspricht

Tabelle 173

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

30 A entspricht

Tabelle 174

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

35 Tabelle A entspricht

Tabelle 175

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii und Va, in denen L_n 2-Methyl,4-methoxycarbonyl, R^3 Cyano bedeuten und R^1 , R^2 für eine Verbindung jeweils einer

40 Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 176

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

Tabelle 177

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

Tabelle 178

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

Tabelle 179

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

Tabelle 180

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

Tabelle A

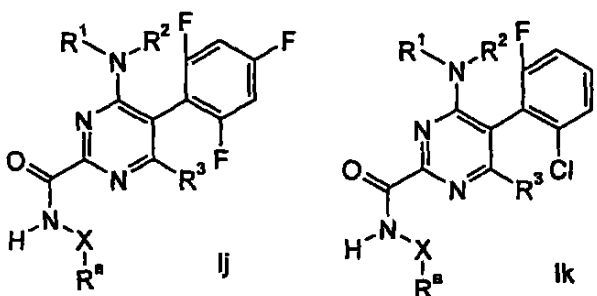
No.	R ¹	R ²
A-1	CH ₂ CH ₃	H
A-2	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-5	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-8	CH ₂ CH ₂ F	H
A-9	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃
A-10	CH ₂ CH ₂ F	CH ₂ CH ₃
A-11	CH ₂ CF ₃	H

No.	R ¹	R ²
A-12	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-13	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CCl ₃	H
A-16	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-17	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-18	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-19	CH(CH ₃) ₂	H
A-20	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-21	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-22	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H
A-24	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-25	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-26	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A-27	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-28	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-30	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-31	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-33	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-34	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-35	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-36	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-37	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-38	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-39	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-40	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-43	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-45	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-47	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-48	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-49	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-52	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-54	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-56	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-57	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-58	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-61	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-63	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-66	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-67	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-70	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-71	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-72	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-73	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-74	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-77	Cyclopentyl	H
A-78	Cyclopentyl	CH ₃
A-79	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-80	Cyclohexyl	H
A-81	Cyclohexyl	CH ₃
A-82	Cyclohexyl	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 -	

No.	R ¹	R 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) ₃ -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) ₂ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-100	(CH ₂) ₂ -  -CH ₂	
A-101	-(CH ₂) ₂ -C(O[CH ₂) ₃ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-102	-(CH ₂) ₂ -CH=CH-CH ₂ -	

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



10 Tabelle 181
Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen NR¹R² 4-Methylpiperidin und R³ Methyl bedeuten und -X-R^a für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 182

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 183

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 CH_2CF_3 , R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 184

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 185

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 186

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 187

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 188

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 189

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methyl bedeuten und $-\text{X}-\text{R}^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 190

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen NR^1R^2 4-Methylpiperidin und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

5 Tabelle 191

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 CH(CH_3)_2$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 192

10 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 CH_2CF_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 193

15 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 (R,S) CH(CH_3)CH_2CH_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 194

20 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 (R) CH(CH_3)CH_2CH_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 195

25 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 (S) CH(CH_3)CH_2CH_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 196

30 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 (R,S) CH(CH_3)CF_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 197

35 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen $R^1 (R) CH(CH_3)CF_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 198

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Chlor bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

5

Tabelle 199

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen NR^1R^2 4-Methylpiperidin und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

10

Tabelle 200

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

15

Tabelle 201

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 CH_2CF_3 , R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

20

Tabelle 202

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

25

Tabelle 203

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

30

Tabelle 204

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

35

Tabelle 205

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 206

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

5

Tabelle 207

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Methoxy bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

10

Tabelle 208

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen NR^1R^2 4-Methylpiperidin und R^3 Cyano bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

15

Tabelle 209

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, R^2 Wasserstoff und R^3 Cyano bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

20

Tabelle 210

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 CH_2CF_3 , R^2 Wasserstoff und R^3 Cyano bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 211

25 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Cyano bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 212

30 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Cyano bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 213

35 Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R^1 (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 Wasserstoff und R^3 Cyano bedeuten und $-X-R^a$ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 214

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R¹ (R,S) CH(CH₃)CF₃, R² Wasserstoff und R³ Cyano bedeuten und -X-R^a für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

5

Tabelle 215

Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R¹ (R) CH(CH₃)CF₃, R² Wasserstoff und R³ Cyano bedeuten und -X-R^a für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

10

Tabelle 216

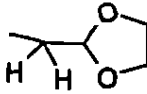
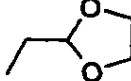
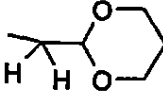
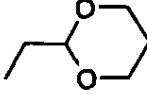
Verbindungen der Formel Ij und Ik in denen R¹ (S) CH(CH₃)CF₃, R² Wasserstoff und R³ Cyano bedeuten und -X-R^a für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

15

Tabelle B

Nr.	X	R ^a
B-1	-(C=O)-	H
B-2		CH ₃
B-3		CH ₂ CH ₃
B-4		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-5		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-6		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-7	-O-	H
B-8		CH ₃
B-9		CH ₂ CH ₃
B-10		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-11		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-12		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-13	-(C=O)-O-	H
B-14		CH ₃
B-15		CH ₂ CH ₃
B-16		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-17		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-18		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-19	-NH-	H
B-20		CH ₃

Nr.	X	R ^a
B-21		CH ₂ CH ₃
B-22		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-23		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-24		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-25	-(C=O)-NH-	H
B-26		CH ₃
B-27		CH ₂ CH ₃
B-28		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-29		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-30		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-31	direkte Bindung	H
B-32		CH ₃
B-33		CH ₂ CH ₃
B-34		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-35		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-36		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-37		CH ₂ OH
B-38		CH ₂ CH ₂ OH
B-39		CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH
B-40		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH
B-41		CH ₂ OCH ₃
B-42		CH ₂ CH ₂ OCH ₃
B-43		CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃
B-44		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃
B-45		CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-46		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-47		CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-48		CH ₂ NH ₂
B-49		CH ₂ CH ₂ NH ₂
B-50		CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂
B-51		CH ₂ NHCH ₃
B-52		CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
B-53		CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
B-54		CH ₂ NHCH ₂ CH ₃
B-55		CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₃
B-56		CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₃
B-57		CH ₂ N(CH ₃) ₂
B-58		CH ₂ SH

Nr.	X	R ^a
B-59		CH ₂ CH ₂ SH
B-60		CH ₂ CH ₂ CH ₂ SH
B-61		CH ₂ SCH ₃
B-62		CH ₂ CH ₂ SCH ₃
B-63		CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃
B-64		CH ₂ SCH ₂ CH ₃
B-65		CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
B-66		CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
B-67		CH(OCH ₃) ₂
B-68		CH ₂ CH(OCH ₃) ₂
B-69		CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂
B-70		
B-71		
B-72		
B-73		
B-74		
B-75		
B-76		CH=CH ₂
B-77		CH=CH ₂ CH ₃
B-78		CH ₂ CH=CH ₂
B-79		CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂
B-80		CH ₂ C≡CH
B-81		CH ₂ CH ₂ C≡CH

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

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

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

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

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

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

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

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis
5 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

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

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

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

20

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

25

- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiernmittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

30

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethy-

35
40

lenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

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

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

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

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

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A) Wasserlösliche Konzentrate (SL)

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

B) Dispergierbare Konzentrate (DC)

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

5

C) Emulgierbare Konzentrate (EC)

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

10

D) Emulsionen (EW, EO)

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

15

20 E) Suspensionen (SC, OD)

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

25

F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

30

35 G) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

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

40

2 Produkte für die Direktapplikation

H) Stäube (DP)

5

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

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

10

0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

15

J) ULV- Lösungen (UL)

20

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

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

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

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

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

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

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

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

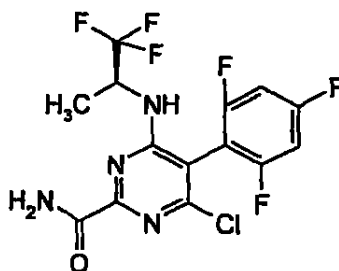
25

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- 30 • Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 35 • Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim,
- 40 Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenami-

- don, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nua-
nmol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam,
Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tncyclazol, Trifonne,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlord, basisches
 - 5 Kupfersulfat,
 - Nitrophenyldervate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
 - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
 - Schwefel
 - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Bentiavalicarb, Carpropamid,
 - 10 Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet,
Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil,
Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorben-
zol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Tolclofos-methyl, Quinto-
zene, Zoxamid
 - 15 • Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl,
Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
 - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
 - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

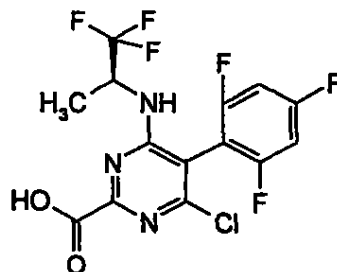
20 Synthesebeispiele

Beispiel 1: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäureamid [1-5]



- 25 Es wurden 5,0 g 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-
phenyl)-pyrimidin-2-carbonitril (s. WO 03/04993, Seiten 28 und 29) in 5 ml DMSO vor-
gelegt, dazu wurden 344 mg K₂CO₃, gegeben und auf 10°C abgekühlt. Anschließend
wurde 1,4 ml 30%iges H₂O₂ hinzugegeben. Es wurde 5 min im Eisbad und danach
noch 30 min bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde in 150 ml
- 30 Wasser eingetragen. Dabei fiel das Amid aus. Das Amid wurde abfiltriert, gewaschen
und im Hochvakuum getrocknet. Es wurden 4,7 g der beige gefärbten Titelverbindung
vom Fp. 157-162°C erhalten.

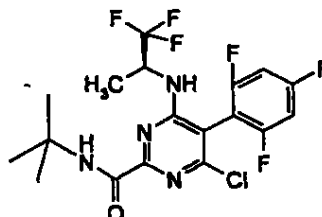
Beispiel 2: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäure [I-11]



Es wurden 1,5 g 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonitril (s. WO 03/04993, Seiten 28 und 29) in 5 ml konz. H₂SO₄ gelöst und 20 min bei 110°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde in 100 ml Eiswasser eingetragen und dabei fiel die Säure aus. Die Säure wurde abfiltriert, mit Wasser gewaschen und im Hochvakuum getrocknet. Man erhielt 1,5 g der gelben Titelverbindung.

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 1.4 (d, CH₃), 4.85 (d, NH), 5.60-5.80 (m, CH), 6.90-7.00 (m, CH), 10.5 (s (breit), OH).

Beispiel 3: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäure-N-tert.butylamid [I-10]



15

a) Zu 5 ml 40 °C warmen Thionylchlorid wurden 1,5 g der Säure (Beispiel 2) gegeben. Die Reaktionsmischung wurde gerührt bis die Gasentwicklung beendet war. Der Ansatz wurde mit Toluol versetzt und das Lösungsmittel sowie überschüssiges Thionylchlorid komplett abdestilliert. Es wurden 1,6 g eines dunkelgrünen Öls erhalten.

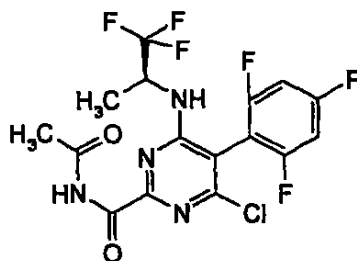
20

b) Es wurden 38 mg tert-Butylamin und 58 mg Triethylamin in 7 ml THF bei 0°C vorgelegt, dazu wurde 200 mg des zuvor hergestellten Säurechlorid, gelöst in 2 ml THF gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 12 Std. bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde einrotiert, in Methyltert.butylether aufgenommen und mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde abgetrennt, über MgSO₄ getrocknet und eingeeengt. Das Rohprodukt wurde mittels präparativer HPLC gereinigt. Es wurden 21 mg der gelben Titelverbindung mit einem Fp von 49-54°C erhalten.

25

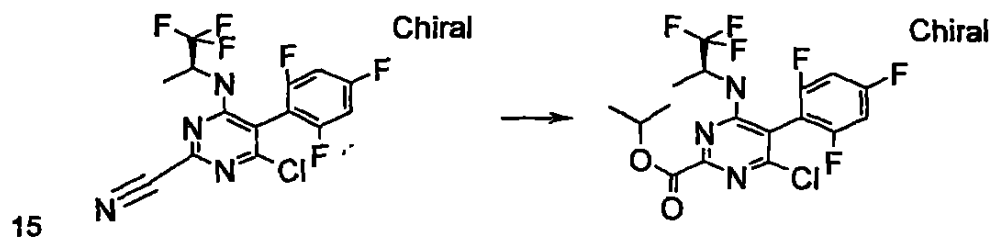
30

Beispiel 4: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyrimidin-2-carbonsäure-N-acetylimid [I-12]



Es wurden 150 mg Amid (Beispiel 1) in 10 ml THF zusammen mit 20 mg Natriumhydrid
5 unter Eisbadkühlung zur Reaktion gebracht und 30 min nachgerührt. Dazu wurden 35 mg Essigsäurechlorid gelöst in 1 ml THF langsam zugegeben. Es wurde 30 min. bei Raumtemperatur nachgerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch mit Eiswasser versetzt und mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Mg_2SO_4 getrocknet und einrotiert. Es wurden 65 mg der rotbraunen Titel-
10 verbindung mit Fp. von 58 bis 65°C erhalten.

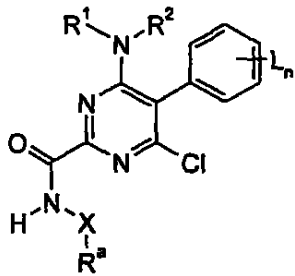
Beispiel 5: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methylethylamino)-5-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyrimidin-2-carbonsäureisopropylester- [V-3]



In 210 ml iso-Propanol wurden bei Raumtemperatur 22 g 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methylethylamino)-5-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyrimidin-2-carbonitril gelöst. In die Lösung wurde während 30 min. HCl-Gas eingeleitet und 96 h bei Rückfluss gerührt.
20 Der Ansatz wurde eingeeengt, mit Wasser versetzt, mit Essigester überschichtet und mit Natriumcarbonat alkalisch gestellt. Die Essigester-Phase wurde mit Magnesiumsulfat getrocknet und einrotiert. Man erhielt 21,4g eines farblosen Feststoffes. Ausbeute: 83,8%
Fp.: 146-147°C

25 Die in den vorstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle I mit physikalischen Daten aufgeführt.
30

Tabelle IA



IA

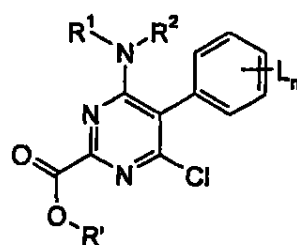
Nr.	R ³ X	R ¹	R ²	L _n	Fp. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
I-1	H	(R,S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2,4,6- Trifluor		0.80-0.90 (m, 2CH ₃), 1.15 (d, CH ₅), 1.75-1.85 (m, CH), 4.25-4.30 (m, CH), 4.60 (s, NH), 6.75 (s, NH), 6.80-6.90 (m, 2CH), 7.70 (s, NH)
I-2	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2,4,6- Trifluor	116- 128	
I-3	H	-CH(CH ₃) ₂	H	2-Chlor- 6-fluor	208- 210	
I-4	NH ₂	-CH(CH ₃) ₂	H	2-Chlor- 6-fluor	103- 108	
I-5	H	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	157- 162	
I-6	NH ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	59- 65	
I-7	H	-CH ₂ C=CH ₂	CH ₂ C=CH ₂	2,4,6- Trifluor	134- 141	
I-8	CH ₃	-CH ₂ C=CH ₂	CH ₂ C=CH ₂	2,4,6- Trifluor	52- 58	
I-9	N(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	39- 45	

Nr.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	Fp. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
I-10	- C(CH ₃) ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	49- 54	
I-11	-OH	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.4(d, CH ₃), 4.85 (d, NH), 5.60-5.80 (m, CH), 6.90-7.00 (m, CH), 10.5 (s(breit), OH)
I-12	(C=O)C H ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	58- 65	
I-13	H	-CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	222- 224	
I-14	-CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.25 (d, 3H), 2.9 (d, 3H), 5.25 (m, 2H), 6.75 (m, 2H), 7.8 (s, 1H)
I-15	H	-CH ₂ -COOH	H	2,4,6- Trifluor	227- 228	
I-16	H	(R)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2,4,6- Trifluor		0.75 (m, 6 H), 1.1 (m, 3H), 1.75 (m, 1H), 4.2 (m, 1H), 4.4 (m, 1H), 5.8 (s, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.4 (m, 1H), 7.6 (s, 1H)
I-17	H	-CH(CH ₃) ₂	H	2-Chlor- 4-fluor	141- 150	
I-18	H	-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	2-Chlor- 4-fluor	48- 56	
I-19	H	(R)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2, 4- Difluor		0.75 (m, 6 H), 1.1 (m, 3H), 1.75 (m, 1H),

Nr.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	Fp. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
						4.2 (m, 1H), 4.5 (m, 1H), 5.85 (s, 1H), 7.1 (m, 2H), 7.3 (m, 1H), 7.6 (s, 1H)
I-20	H	-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	2, 4- Difluor	53- 58	
I-21	H	-CH(CH ₃) ₂	H	2, 4- Difluor	172- 176	
I-22	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2, 4- Difluor	50- 63	
I-23	H	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2, 4- Difluor	99- 105	
I-24	H	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2-Chlor- 4-fluor	79- 88	
I-25	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2, 6- Difluor	173- 175	
I-26	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2-Chlor- 4-fluor	175- 177	
I-27	H	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2, 6- Difluor	206- 208	
I-28	H	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2, 6- Difluor	128- 130	
I-29	H	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2-Chlor- 4-fluor	165- 167	
I-30	(C=O)C H ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2-Chlor- 4-fluor		0.9 (d, 3H), 1.0 (m, 2H), 2.6 (s, 3H), 4.0 (m, 2H), 7.1 (m, 1H), 7.25 (m, 2H), 10.0 (s, 1H)

Nr.	R ⁿ X	R ¹	R ²	L _n	Fp. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
I-31	H	(S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2-Chlor- 4- methoxy	84- 88	
I-32	H	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.4 (m, 3 H), 3.9 (s, 3 H), 5.0 (d, 1H), 5.25 (m, 1H), 6.8 (m, 2H)
I-33	(C=O)C H ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2, 6- Difluor		0.9 (d, 3H), 1.0 (m, 2H), 1.6 (s, 3H), 2.8 (s, 3H), 4.0 (m, 2H), 7.0 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 10.0 (s, 1H)

Tabelle VA



VA

Nr.	R'	R ¹	R ²	L _n	Fp. [°C]	¹ H-NMR [CDCl ₃ , ppm]
V-1	CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.3 (d, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.6 (d, NH), 5.25 (m, 1H), 6.9 (m, 2H)
V-2	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ C=CH ₂	- CH ₂ C=CH ₂	2,4,6- Trifluor	53- 57	
V-3	-CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	146- 147	
V-4	-CH ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.35 (d, 3H), 1.45 (t, 3H), 4.5 (q, 2H), 4.6 (d, NH), 5.3 (m, CH), 6.9 (m, 2H)
V-5	-(CH ₂) ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	100- 105	
V-6	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	115- 118	
V-7	-(CH ₂) ₃ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	71- 75	
V-8	-(CH ₂) ₄ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	82- 88	
V-9	-(CH ₂) ₆ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	57- 60	
V-10	-CH ₂ CF ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.35 (d, 3H), 4.7 (d, NH), 4.8 (m, 2H), 5.3 (m, 1H), 6.9 (m, 2H)
V-11	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	90- 93	
V-12	-CH ₂ CH(CH ₃)- CH ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor	75- 81	

Nr.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	Fp. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
V-13	-CH(CH ₃)- (CH ₂) ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃		2,4,6- Trifluor		0.9 (t, 3H), 1.3- 1.9 (m, 13H), 4.55 (d, NH), 5.25 (m, 2H), 6.9 (m, 2H)
V-14	-CH(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2,4,6- Trifluor		0.8 (d, 3H), 0.9 (m, 2H), 1.4 (d, 6H), 1.5 (m, 3H), 2.7 (t, 2H), 3.9 (d, 2H), 5.2 (m, CH), 6.7 (m, 2H)
V-15	-CH(CH ₃)- CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.0 (m, 6H), 1.4 (m 6H), 2.0 (m, CH), 4.6 (m, NH), 5.0 (m, CH), 5.3 (m, CH), 6.9 (m, 2H)
V-16	-CH ₂ C=CH ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.35 (d, 3H), 4.8 (d, 2H), 4.95 (d, 1H), 6.3 (m, 2H), 5.45 (d, 1H), 6.1 (m, 1H), 6.9 (m, 1H)
V-17	-(CH ₂) ₂ NH ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.0 (m, 6H), 1.4 (m 6H), 2.0 (m, CH), 4.6 (m, NH), 5.0 (m, CH), 5.3 (m, CH), 6.9 (m, 2H)
V-18	Cyclohexyl	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- Trifluor		1.35 (d, 3H), 4.8 (d, 2H), 4.95 (d, 1H), 6.3 (m, 2H), 5.45 (d,

						1H), 6.1 (m, 1H), 6.9 (m, 1H)
V-19	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-Trifluor	97-102	
V-20	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃ -	H	2,4,6-Trifluor	145-146	
V-21	-CH ₂ C ₆ H ₅	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-Trifluor		1.4 (d, 3H), 4.55 (m, 3H), 5.25 (m, 1H), 6.9 (m, 2H), 7.3-7.5 (m, 5H)
V-22	Cyclopentyl	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-Trifluor	114-115	
V-23	Cyclobutyl	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-Trifluor	127-129	

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

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

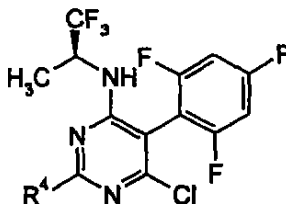
Die Wirkstoffe wurden getrennt als Stammlösung formuliert mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt. Die Stammlösungen der Wirkstoffe wurden entsprechend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

15 Anwendungsbeispiele

1. Wirkung gegen die Krautfäule an Tomaten verursacht durch *Phytophthora infestans* bei protektiver Behandlung

20 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporangienaufschwemmung von *Phytophthora infestans* infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 18

und 20°C aufgestellt. Nach 6 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

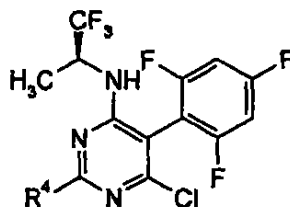


Nr.	R ⁴	Dokument	Befall bei 250 ppm a.i. (%Blattfläche)
I-5	-(C=O)NH ₂	erfindungsgemäß	0
V-3	-(C=O)-O-CH(CH ₃) ₃	erfindungsgemäß	5
V1	-(C=NOCH ₃)NH ₂	WO 03/043993	80
	unbehandelt		80

5

2. Dauerwirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani* bei protektiver Behandlung

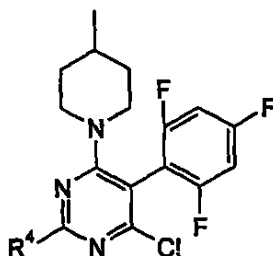
- Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfmasse besprüht. Um die Dauerwirkung zu testen wurden erst sieben Tage später die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomatzlösung mit einer Dichte von 0.17×10^6 Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt
- 15 Nach weiteren 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.



Nr.	R ⁴	Dokument	Befall bei 16 ppm a.i. (%Blattfläche)
I-5	(C=O)NH ₂	erfindungsgemäß	30
V1	(C=NOCH ₃)NH ₂	WO 03/043993	67
	unbehandelt		90

3. Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

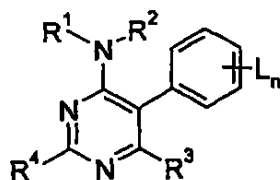
- 5 Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 - 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen
- 10 Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die 1.7×10^6 Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.



Nr.	R ⁴	Dokument	Befall bei 16 ppm a.i. (%Blattfläche)
I-2	-(C=O)NH ₂	erfindungsgemäß	15
V2	-(C=NOCH ₃)NH ₂	Beispiel I-186 aus WO 03/043993	90
	unbehandelt		100

Patentansprüche

1 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I



5 in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben.

10 n eine ganze Zahl von 1 bis 5;

L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyloxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₄-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkyloxy, C₄-C₈-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 oder S(=O)_m-N(A')A,

15 m 0, 1 oder 2;

20 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Nitro, Cyanato, Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen,

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

R^u Cyano, C₁-C₈-Alkoxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyloxy, C₄-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkyloxy, C₄-C₈-Cycloalkenyloxy

$-\text{C}(=\text{O})-\text{A}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{A}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{C}(\text{A}')(\text{=N-OA})$, $\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{N}(\text{A}')-\text{C}(=\text{O})-\text{A}$, $\text{N}(\text{A}'')-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{S}(=\text{O})_m-\text{A}$, $\text{S}(=\text{O})_m-\text{O}-\text{A}$ oder $\text{S}(=\text{O})_m-\text{N}(\text{A}')\text{A}$;

5 R^1, R^2 unabhängig voneinander C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Halogenycycloalkyl, wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^1 und R^2 ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R^v tragen können:

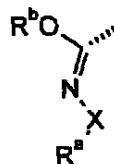
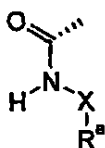
10 R^v Cyano, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_4-C_6 -Cycloalkenyl, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_6 -Alkenyloxy, C_2-C_6 -Alkinyloxy, C_3-C_6 -Cycloalkyloxy, C_4-C_6 -Cycloalkenyloxy, C_1-C_6 -Alkylthio, $-\text{C}(=\text{O})-\text{A}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{A}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{C}(\text{A}')(\text{=N-OA})$, $\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{N}(\text{A}')-\text{C}(=\text{O})-\text{A}$, $\text{N}(\text{A}'')-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{S}(=\text{O})_m-\text{A}$, $\text{S}(=\text{O})_m-\text{O}-\text{A}$ oder $\text{S}(=\text{O})_m-\text{N}(\text{A}')\text{A}$ oder Phenyl, wobei der Phenylteil ein bis
15 drei Reste ausgewählt aus der Gruppe 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, $-\text{C}(=\text{O})-\text{A}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{A}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{A}')\text{A}$, $\text{C}(\text{A}')(\text{=N-OA})$, $\text{N}(\text{A}')\text{A}$ tragen kann;

20 R^2 kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether $-(\text{O}-)$, Carbonyl $-(\text{C}=\text{O})-$, Thio $-(\text{S}-)$, Sulfoxyl $-(\text{S}=\text{O})-$ oder Sulfenyl $-(\text{SO}_2-)$ oder eine weitere Amino $-(\text{N}(\text{R}^a)-)$ Gruppe, wobei R^a Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl und Oxy- C_1-C_3 -alkylenoxy enthalten kann;

30 R^3 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_4 -Alkoxy, C_3-C_4 -Alkenyloxy, C_3-C_4 -Alkinyloxy, C_1-C_6 -Alkylthio, Di- $(\text{C}_1-\text{C}_6\text{-alkyl})$ amino oder C_1-C_6 -Alkylamino, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von R^3 durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_2 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein können;

35 R^4 einer der Formeln



entspricht, in denen

- 5 X eine direkte Bindung, $-(C=O)-$, $-(C=O)-NH-$, $-(C=O)-O-$, $-O-$, $-NR^c$, $-CH_2O-(C=O)-$, $-C=C-(C=O)-$, wobei der jeweils linke Molekulteil an das Stickstoffatom gebunden ist;
- 10 R^a Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder Benzyl;
- R^b Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl oder C_2-C_6 -Alkynyl;
- 15 R^c Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, Benzyl oder C_1-C_6 -Acyl
bedeuten,
wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Res-
tedefinitionen von R^a , R^b und/oder R^c ihrerseits eine bis vier Gruppen R^w tra-
gen können:
- 20 R^w Halogen, Cyano, OR^x , NHR^x , SR^x , C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_1-C_6 -Alkoxy, 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, wobei
- R^x Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder Benzyl bedeutet.
- 25 2 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I nach Anspruch 1, in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:
- 30 n eine ganze Zahl von 1 bis 3, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt;
- L Halogen, Cyano, Methyl, Methoxy, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$,
- 35 A, A' unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder voll-
ständig halogeniert sein können oder durch C_1-C_4 -Alkoxy substituiert
sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie ge-
bunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten Heterocyc-
lus, enthaltend ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe O, N oder
40 S, stehen;

wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

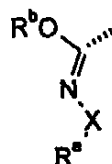
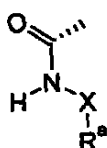
- 5 R^1, R^2 unabhängig voneinander C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_2-C_6 -Halogenalkenyl oder C_2-C_6 -Halogenalkinyl,

R^2 kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

- 10 R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether $-(O-)$ oder eine weitere Amino- $(-N(R^a)-)$ Gruppe, wobei R^a Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl und Oxy- C_1-C_3 -alkylenoxy enthalten kann;

R^3 Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Haloalkyl;

- 20 R^4 einer der Formeln



entspricht, in denen

- 25 X eine direkte Bindung, $-(C=O)-$, $-(C=O)-NH-$, $-(C=O)-O-$, $-O-$, $-NR^c-$, wobei der jeweils linke Molekülteil an das Stickstoffatom gebunden ist;

R^a Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl,

- 30 R^b Wasserstoff, C_1-C_4 -Alkyl, Allyl oder Propargyl;

R^c Wasserstoff, Methyl oder C_1-C_4 -Acyl bedeuten,

- 35 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^a , R^b und/oder R^c ihrerseits eine oder zwei Gruppen R^w tragen können:

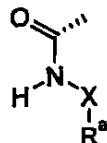
R^w Halogen, OR^x , NHR^x , C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl, C_1-C_4 -Acylamino, [1,3]Dioxolane- C_1-C_4 -alkyl, [1,3]Dioxane- C_1-C_4 -alkyl, wobei

R^x Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl bedeutet

5

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

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

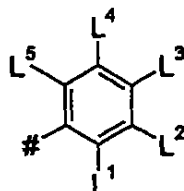


10

entspricht, wobei X für eine direkte Bindung, $-O-$ oder $-(C=O)-O-$ steht, und R^a Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl bedeutet

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

15



B

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

20

L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ;

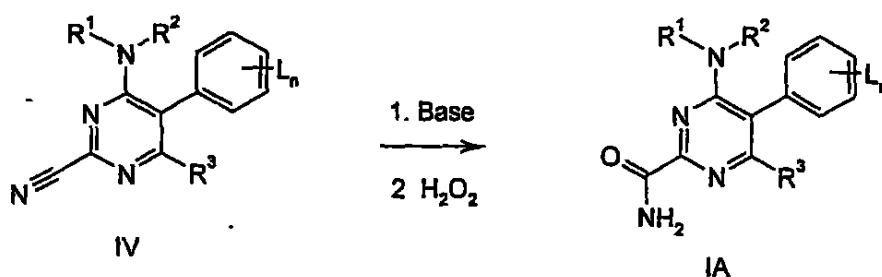
L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, CH_3 oder Fluor;

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

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

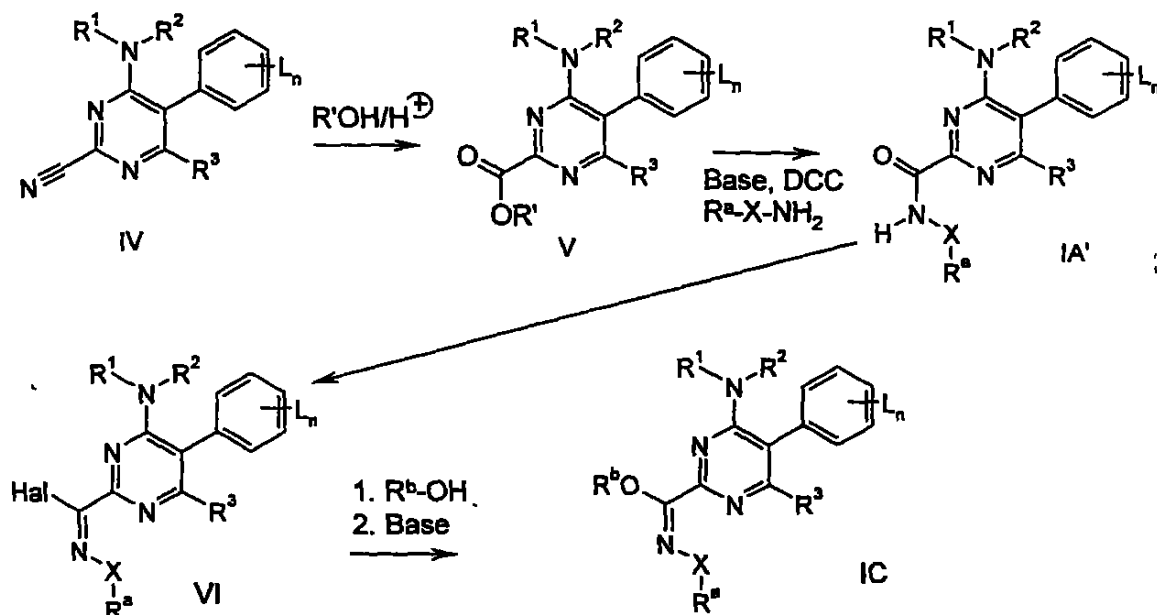
25

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen IA, durch Hydrolyse



der Nitrile der Formel IV, wobei die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und L sowie der Index n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, dadurch gekennzeichnet, dass in Gegenwart einer Base und Wasserstoffperoxid hydrolysiert wird.

- 5 7. Verfahren zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen IA' und IC, wobei die Substituenten L_n , R^1 , R^2 , R^3 , X , R^a und R^b die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, ausgehend von Nitrilen der Formel IV,

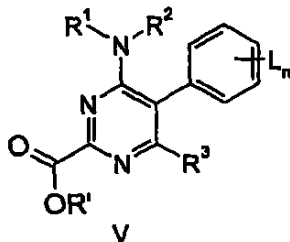


10

die mit Alkoholen der Formel $R'OH$, wobei R' C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_8 -Alkenyl, C_2-C_8 -Alkynyl oder C_3-C_6 -Cycloalkyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl partiell oder vollständig halogeniert sein können und eine bis drei Gruppen R^y tragen können, bedeutet, zu den Estern der Formel V, anschließend mit Aminen R^a-X-NH_2 unter Zusatz wasserentziehender Mittel zu den Amiden IA' und weiterhin in Gegenwart von Tetrahalogenkohlenstoff und Triarylphosphin zu den Iminhalogeniden der Formel VI und schließlich mit Alkoholen der Formel R^bOH und Basen zu den Iminoethern der Formel IC umgesetzt werden

15

- 20 8. Ester der Formel V



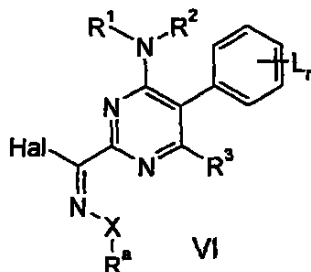
65

in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und L_n die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben und R' C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl partiell oder vollständig halogeniert sein können und eine bis drei Gruppen R' tragen können, bedeutet.

5

9. Ester V gemäß Anspruch 8, wobei R' Isopropyl bedeutet

10 Iminhalogenide der Formel IV



10

wobei die Substituenten L_n , R^1 , R^2 , R^3 , X und R^a die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben und Hal für Fluor, Chlor, Brom oder Iod steht.

11. Pestizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

15

12. Pestizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel V gemäß einem der Ansprüche 8 oder 9

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

20

14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die von Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel V gemäß einem der Ansprüche 8 oder 9 behandelt.

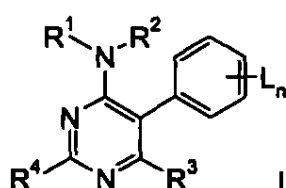
25

PF 55127

Primidinas 2-sustituidas

Descripción

5 La invención se refiere a pirimidinas 2-sustituidas 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;

15 L es halógeno, ciano, cianato (OCN), alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, -alcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, cilcoalquilo C₃-C₆, cilcoalquenilo C₄-C₆, cilcoalquinox C₃-C₆, cilcoalqueniloxi 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 es 0, 1 ó 2,

20 A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cilcoalquilo C₃-C₆, cilcoalquenilo C₃-C₆, fenilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o completamente

PF 55127

2

te halogenados o sustituidos por nitro, cianato, ciano o alcoxi C₁-C₄, o
 pudiendo A y A' formar juntos con los átomos a los que están ligados
 un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cin-
 co o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del
 grupo O, N o S,

pudiendo los grupos alifáticos de las demás definiciones de L estar parcial o
 completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u

10 R^u significa ciano, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, al-
 quinioloxi C₂-C₆, cicloalquenilo C₄-C₆, cicloalquiloxi C₃-C₆, cicloalqueni-
 loxi C₄-C₆, -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-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqui-
 nilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halógenocicloalquilo C₃-C₆, pudiendo los gru-
 pos alifáticos de las definiciones de los radicales R¹ y R² a su parte estar
 parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^v:

20 R^v ciano, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₄-C₆, hidroxil, alcoxi C₁-C₆,
 alqueniloxi C₂-C₆, alquinioloxi C₂-C₆, cicloalquiloxi C₃-C₆, cicloalqueni-
 loxi C₄-C₆, alquiltio C₁-C₆, -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
 25 S(=O)_m-N(A')A o fenilo, pudiendo la parte de fenilo llevar uno a tres radica-

PF 55127

3

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,

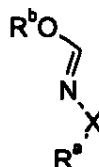
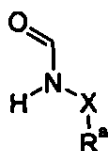
5 R² puede significar adicionalmente hidrógeno;

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-), sulfonilo -(S(=O)-) o sulfenilo -(SO₂-) o un grupo amino -(N(R^a)) adicional, donde R^a es hidrógeno o alquilo C₁-C₆, y/o contener uno o varios sustituyentes del grupo. halógeno, alquilo C₁-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆ y oxi alquilenoxi C₁-C₃;

15 R³ es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₃-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 alcóxicarbonilo C₁-C₄,

20

R⁴ corresponde a una de las fórmulas



PF 55127

4

donde

- 5 X significa un enlace directo, $-(C=O)$, $-(C=O)-NH$, $-(C=O)-O$, $-O$, $-NR^c$, $-CH_2-$
 $O-(C=O)$, $-C=C-(C=O)$, estando cada vez el átomo izquierdo del miembro
 de puente ligado con el átomo de nitrógeno;
- R^a significa hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 o bencilo,
- R^b es hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 o alquinilo C_2-C_8 ;
- 10 R^c es hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , bencilo o acilo
 C_1-C_8
 pudiendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos de las definiciones
 de los radicales de R^a , R^b y/o R^c a su vez llevar uno a cuatro grupos R^w
- 15 R^w significa halógeno, ciano, OR^x , NHR^x , SR^x , alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 ,
 alquinilo C_2-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alcóxicarbonilo C_1-C_4 , acilamino C_1-C_4 ,
 [1,3]dioxolanoalquilo- C_1-C_4 , [1,3]dioxano -alquilo- C_1-C_4 , donde
- 20 R^x significa hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 o
 bencilo.

Además, la invención se refiere a un procedimiento par a la obtención de estos com-
 puestos, a productos que contienen 2-pirimidinas, así como al uso de los mismos para
 25 combatir hongos fitopatógenos.

PF 55127

5

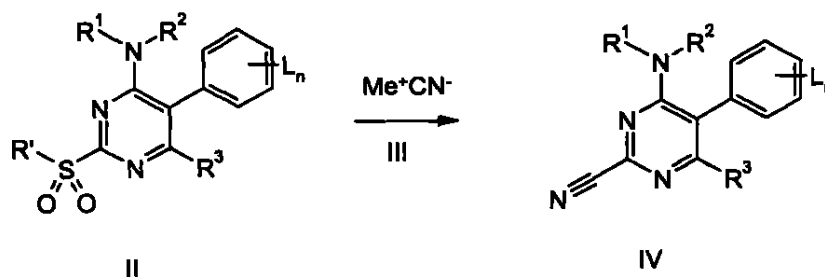
De la WO-A 01/96314 se conocen pirimidinas fungicidas, que en la posición 2 llevan un sustituyente cianamino. Además, se conocen de la WO-A 03/43993 2-pirimidil-N-metoxiamidinas fungicidas.

- 5 Sin embargo, el efecto de las pirimidinas arriba indicadas es insatisfactorio en muchos casos. Por tanto, el objeto era hallar compuestos con eficiencia mejorada.

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

Los compuestos I se pueden preparar mediante diferentes métodos:.

- 1) 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. Transformando las
15 sulfonas II con cianuros de metal III (Me^+CN^-) se obtienen los nitrilos IV. Bajo cianuros de metal se entienden en primera línea cianuros de metal alcalino o alcalinotérreo o también cianuros covalentes, tales como cianuro de estaño



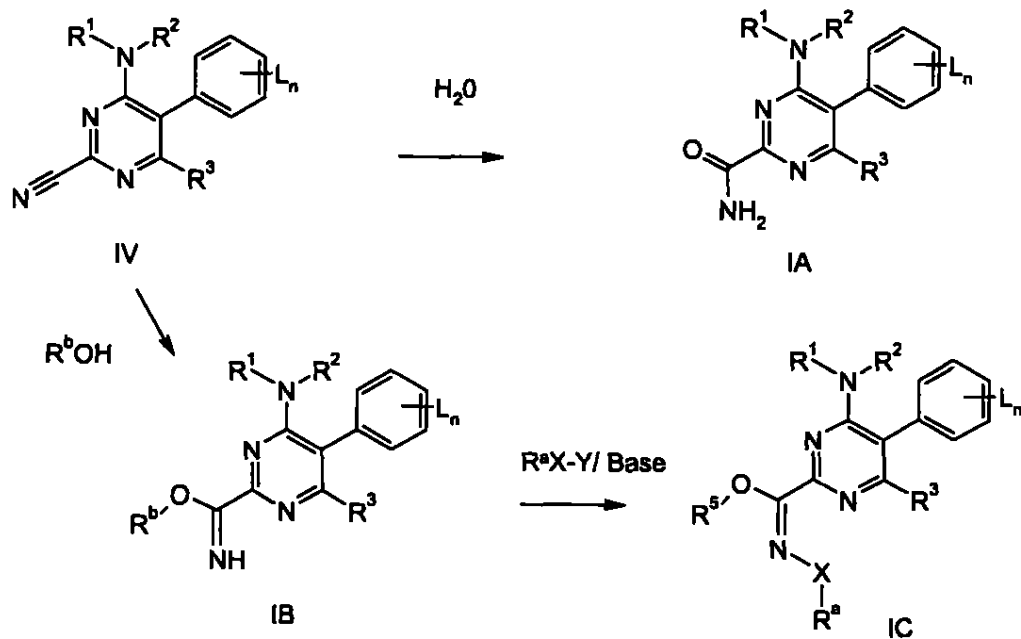
- 20 El intercambio del grupo sulfonato por el grupo nitrilo se efectúa mediante métodos conocidos de la literatura, tal y como se describen, por ejemplo, en la WO-A 03/043993.

PF 55127

6

Otra síntesis puede efectuarse de acuerdo con el esquema 1.

Esquema 1.



- 5 El compuesto nitrilo IV puede ser hidrolizado con sulfuro de hidrógeno bajo condiciones preferentemente ácidas, dando la tiamida IA. La hidrólisis se realiza, por ejemplo, bajo las condiciones descritas por Katritzky et al. en *Synthesis* 1989, p. 949-950 (peróxido de hidrógeno, base, disolvente aprótico polar). En *Comprehensive Organic Chemistry*, Vol 2, Sutherland, I O Pergamon Press, Oxford, 1979, p. 964 se describen hidrólisis
- 10 de nitrilos en amidas bajo condiciones ácidas.

Alternativamente, se puede transformar el aducto de Pinner, que se ha formado por adición de, generalmente, ácido clorhídrico al nitrilo IV, con un alcohol de la fórmula R^bOH , donde R^b tiene los significados arriba indicados, dando el imino éter de la fórmula IB. La alquilación con R^aX-Y , donde R^a y el miembro de puente X tienen los signi-

15

PF 55127

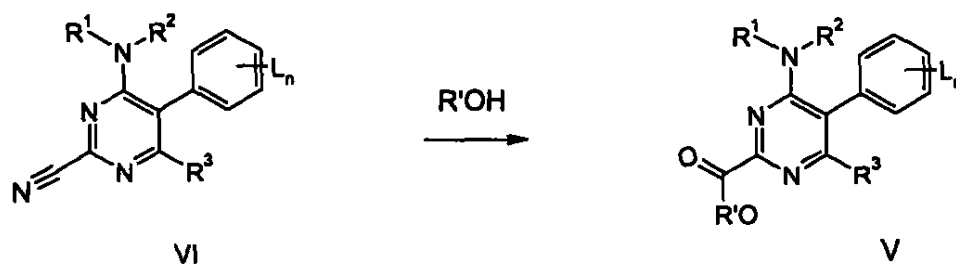
7

ficados arriba indicados e y representa un grupo disociable, como p.ej. haluro, sulfato o sulfonato, proporciona compuestos del tipo IC.

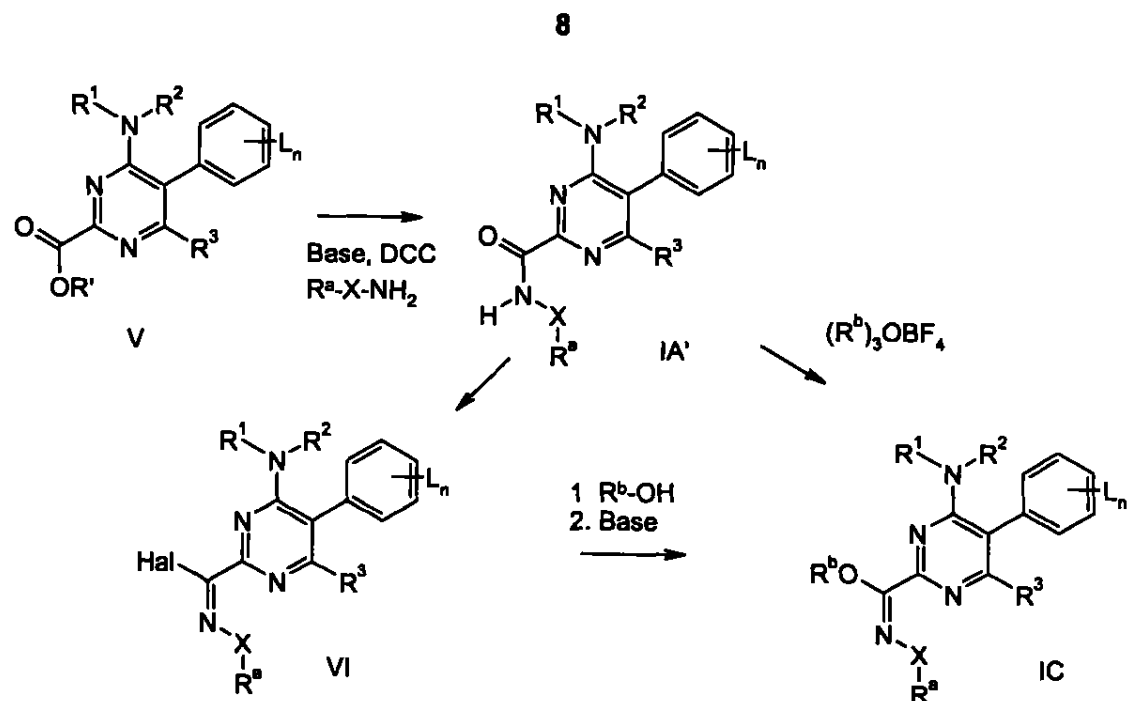
La alquilación con R^a-Y se puede realizar partiendo del compuesto IB o el nitrilo IV con
5 sales de Meerwein de la fórmula $(R^a)_3OBF_4$ en analogía a las prescripciones descritas en Synth. Commun , 1983, 13, p. 753 o Helv. Chim. Acta, 1986, 69, p. 1224. Se obtienen los compuestos I, en los que Y significa un enlace directo.

Una síntesis alternativa de los compuestos IA de la invención está representada en el
10 esquema 2.

Esquema 2:



PF 55127



- La síntesis representada en el esquema 2 de los compuestos IA' y IC parte a su vez del nitrilo IV. La formación del nitrilo IV puede efectuarse, preferentemente, bajo condiciones ácidas, en presencia de alcoholes de la fórmula R'OH, donde R' significa alquilo C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈ o hidroalquilo C₃-C₆, pudiendo los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo estar parcial o completamente halogenados y llevar uno a tres grupos R'. La transformación de V con aminas en las amidas IA' puede realizarse 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 transformación con sales de Meerwein de la fórmula (R^b)₃OBF₄ en analogía a las prescripciones indicadas en Synth Commun, 1983, 13, p. 753 o Helv Chim.Acta, 1986, 69, p. 1224, proporciona los compuestos según la invención de la fórmula IC. Los iminohaluros de la fórmula VI, donde Hal significa halógeno y, especialmente, cloro y bromo, pueden ser preparados análogamente a Synthesis, 1991, Vol 9, p. 750-752. En una reacción de Appel se preparan, por ejemplo con tetrabromuro de carbono y trifenilfosfina los correspondientes compuestos

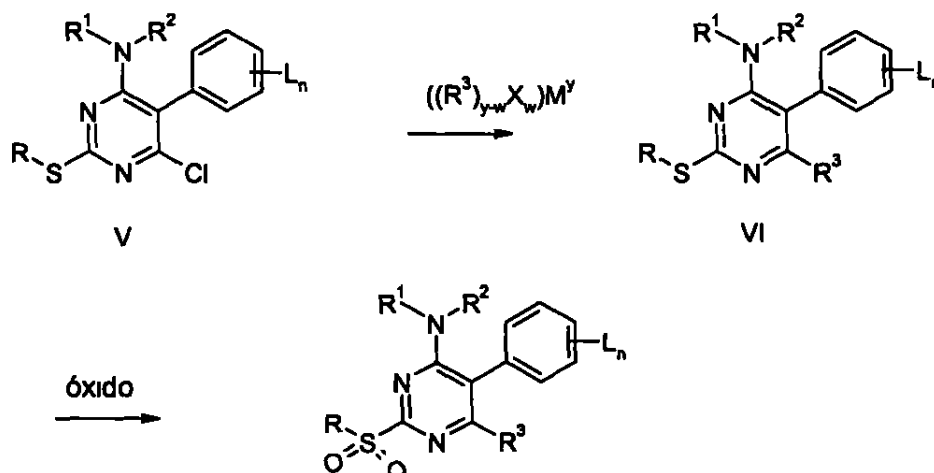
PF 55127

9

de bromo. Estos últimos se pueden transformar, finalmente, con alcoholes de la fórmula R^bOH y bases en los compuestos según la invención IC.

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

Esquema 3



10

En la fórmula $((R^3)_yX_w)M^y$ representa M un ión de metal de la valencia Y, por ejemplo, B, Zn, Mg, Cu o Sn, X representa cloro, bromo, yodo o hidróxido, R^3 representa, preferentemente, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y w es un número entero de 0 a 3.

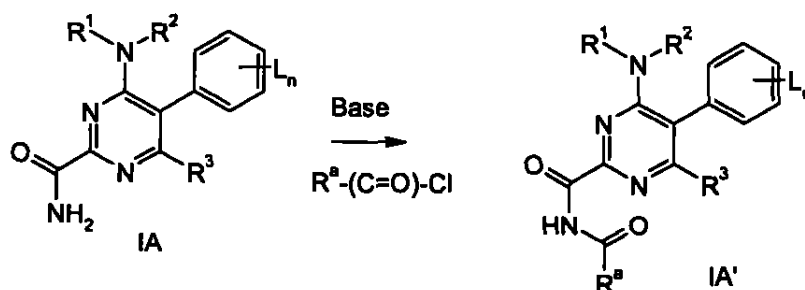
Esta reacción puede ser efectuada, por ejemplo, en analogía a los métodos siguientes:

- 15 J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), loc. cit. 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255, Aust. J. Chem., Vol. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Vol. 43, 358 (1978), J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979), Tetrahedron Lett., Vol. 34, 8267 (1993); loc. cit., Vol. 33, 413 (1992).

PF 55127

10

El sustituyente R^a en la fórmula IA' también puede ser introducido en la forma indicada en el esquema 4.



- Aquí se transforman los compuestos de la fórmula IA, primero con bases fuertes en el anión y luego con correspondientes cloruros de ácido en IA' (ver J. Chem. Soc., Perkin Trans I, 1995, p. 3043). De esta manera se obtienen compuestos, en los que X representa un miembro de puente C=O. Como bases para la obtención del anión son apropiados, por ejemplo, amida de sodio e hidruro de sodio.
- 10 Las indicaciones arriba mencionadas se refieren, especialmente a la obtención de compuestos, en los que R^3 representa un grupo alquilo. Siempre que R^3 represente un grupo ciano o un sustituyente alcoxi, el radical R^3 puede ser introducido por reacción con cianuros de metal alcalino o bien alcoholatos de metal alcalino.
- 15 En las definiciones de los símbolos indicados en la fórmula se han usado términos colectivos, que son generalmente representativos de los siguientes sustituyentes
- halógeno:** flúor, cloro, bromo e yodo,
- 20 **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,

PF 55127

11

propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo,

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 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;

alqueno: 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 C₂-C₈-alqueno como p.ej. etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metilethenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-

PF 55127

12

- 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,

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

- 15 **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 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,

20

- alquínilo:** grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 8 átomos de carbono y un triple enlace en una posición arbitraria, p.ej. alquínilo C_2-C_8 , como p.ej. etínilo, 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-
- 25

PF 55127

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,

5

cicloalquilo: grupos hidrocarburo mono o bicíclicos, saturados con 3 a 6 miembros anulares de carbono, p ej. cicloalquilo C₃-C₆, como p ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo, ciclohexilo;

10

heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo. O, N o S:

- **heterociclilo 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 y/o de azufre, p.ej. 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo,

15

20

25

PF 55127

14

- 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-hexahidropindacinilo, 4-hexahidropiridacinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropinmidinilo, 2-piperacinilo, 1,3,5-hexahidro-triacin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotriacin-3-ilo,
- 20 - **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-
- 25

PF 55127

15

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
5 1,3,4-triazol-2-ilo;

- **heteroarilo de seis miembros**, que contiene uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo hexacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno
10 como miembros del anillo, p.ej. 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridacnilo, 4-piridacnilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-piracnilo, 1,3,5-triacn-2-ilo y 1,2,4-triacn-3-ilo;

En el ámbito de la presente invención están comprendidos los isómeros (R) y (S) y los
15 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 pirimidias de la fórmula I, se prefieren
20 los siguientes significados para los sustituyentes, tanto por sí solos como en combinaciones:

Se prefieren los compuestos, en los que R¹ significa alquilo C₁-C₆-, halógenoalquilo C₁-C₆-, alquenilo C₂-C₆-, alquinilo C₂-C₆ o cilcoalquilo C₃-C₆ y R² significa hidrógeno.

25

1

PF 55127

16

Se prefieren, especialmente, los compuestos I, en los que R¹ significa alquilo C₁-C₆ ramificado en la posición, alquenilo C₂-C₆ o halógenoalquilo C₁-C₆.

Además, se prefieren los compuestos I, en los que R¹ significa halógenoalquilo C₁-C₄ y

5 R² significa hidrógeno

Adicionalmente, se prefieren los compuestos I, en los que R¹ y R² forman junto con el nitrógeno al que están ligados un anillo de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un átomo de oxígeno o llevar uno o dos sustituyentes que lleve con 1 a

10 6 átomos de carbono.

Son especialmente preferidos los grupos NR¹R² como, por ejemplo pirrolidina o piperidinas metiladas, especialmente, en la posición α . Además, son preferidas la 4-metilpiperidina

15

Son especialmente preferidas las pirimidinas I, en las que los sustituyentes L¹ a L⁵ tienen los significados siguientes:

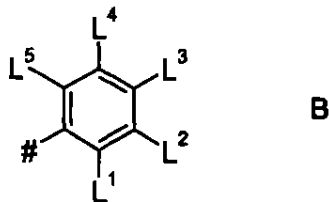
L significa halógeno, clavo, alquilo C₁-C₆-, alcoxi C₁-C₆-, -C(=O)-O-A, -C(=O)-
20 N(A')A,

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆-, alquenilo C₂-C₆-, alquinilo C₂-C₆.

PF 55127

17

Además, se prefieren las pirimidinas I, en las que el grupo fenilo sustituido por L_n representa el grupo B



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

5

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

10

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

15

Además, son especialmente prefendos los compuestos I, en los que R^3 significa halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4

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

20

Con respecto a su efecto fungicida son preferidas las pirimidans de la fórmula I, en la que R^4 significa

PF 55127

18



Además, son preferidas las pirimidinas de la fórmula I en la que R⁴ significa



5

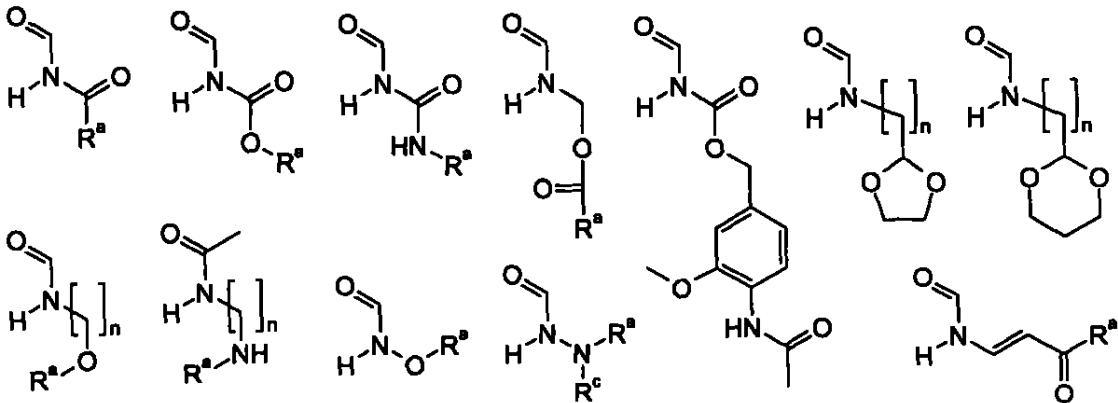
Son especialmente preferidas las pinmidas de la fórmula I, en la que R⁴ significa



10

Finalmente, R⁴ puede tener, preferentemente los significados siguientes, que también pueden ser considerados como definiciones de radicales prodrug (ver Medicininal Research Reviews 2003, 23, 763 – 793, o J. of Pharmaceutical Sciences 1997, 86, 765-

15 767):

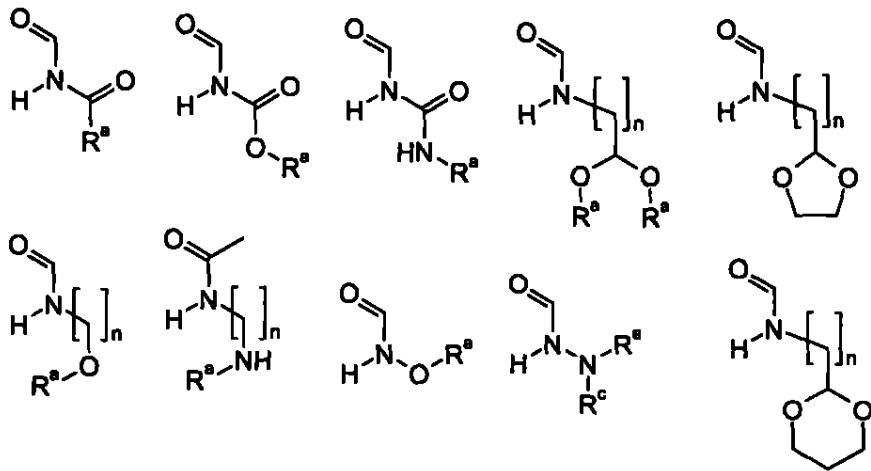


El índice n en los radicales alquenilo de las fórmula arriba indicadas representa un número entero de 1 a 3.

PF 55127

19

Son especialmente prefendas las definiciones para R⁴:



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

5

El sustituyente R^a representa, preferentemente, hidrógeno, metilo, bencilo, trifluorometilo, alilo, propargilo o metoximetilo y, especialmente, hidrógeno.

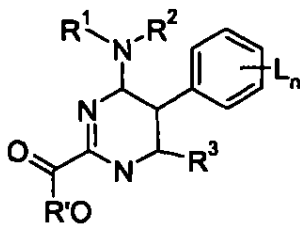
El sustituyente R^b significa, preferentemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o alquenilo C₂-C₆ y, especialmene, metilo, alilo o propargilo.

10

El sustituyente R^c representa, preferentemente hidrógeno o metilo

Los ésteres de la fórmula V son tanto interesantes productos intermedios como también excelentes principios activos fungicidas

15



PF 55127

20

Las definiciones preferidas de Ln, R1 a R3 antes mencionadas valen en igual sentido para los ésteres de la fórmula V.

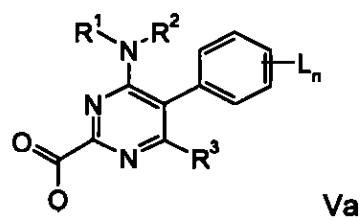
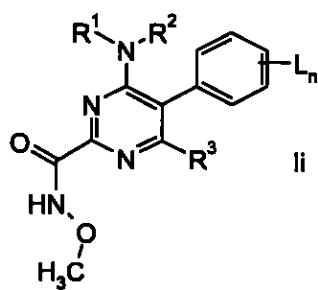
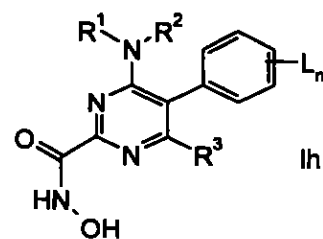
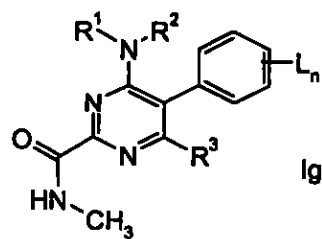
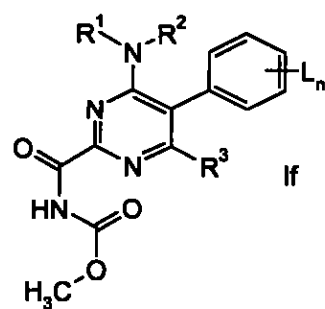
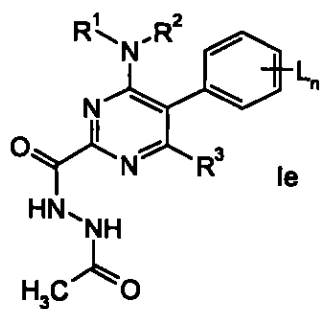
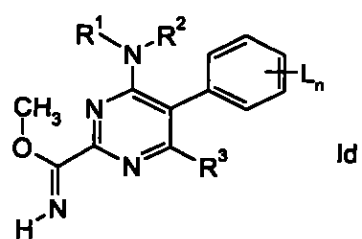
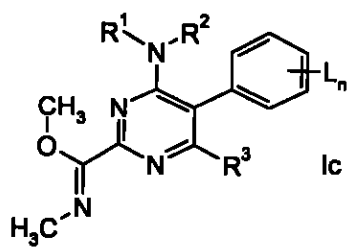
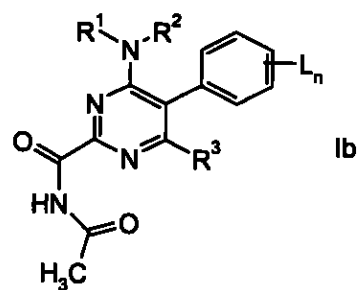
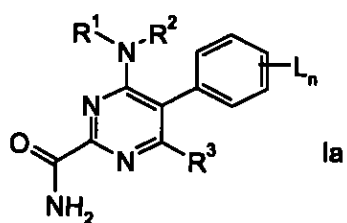
R' representa, especialmente un radical alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, sobre
5 todo, un radical isopropilo.

Pero R' también puede significar alquilo, propilo, bencilo, aminoalquilo, hidroxialquilo, alcoxialquilo o halógenoalquilo.

10 Especialmente, con respecto a su uso se prefieren los compuestos I y V representados en las siguientes Tablas. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente representan, además, considerados por si solos, independientemente de la combinación en que se mencionan, una variante especialmente preferida del respectivo sustituyente.

PF 55127

21



PF 55127

Tabla 1

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

Tabla 2

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

Tabla 3

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,6-dicloro, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez una
15 línea de la Tabla A

Tabla 4

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2-fluoro,6-metilo, R³ significa metilo y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez
20 una línea de la Tabla A

Tabla 5

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

PF 55127

Tabla 6

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

5

Tabla 7

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

10

Tabla 8

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

15

Tabla 9

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

20

Tabla 10

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

25

PF 55127

24

Tabla 11

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

5

Tabla 12

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

10

Tabla 13

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

15

Tabla 14

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

20

Tabla 15

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

25

PF 55127

25

Tabla 16

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

5

Tabla 17

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,5-difluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 18

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

15

Tabla 19

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

20

Tabla 20

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

25

PF 55127

Tabla 21

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

5

Tabla 22

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

10

Tabla 23

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

15

Tabla 24

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

20

Tabla 25

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

25

PF 55127

27

Tabla 26

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

5

Tabla 27

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

10

Tabla 28

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

15

Tabla 29

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

20

Tabla 30

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

25

PF 55127

Tabla 31

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

5

Tabla 32

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

10

Tabla 33

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

15

Tabla 34

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

20

Tabla 35

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

25

PF 55127

29

Tabla 36

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

5

Tabla 37

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

10

Tabla 38

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

15

Tabla 39

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

20

Tabla 40

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

25

PF 55127

30

Tabla 41

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,5-dimetilo,4-brom, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

5

Tabla 42

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

10

Tabla 43

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

15

Tabla 44

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2-fluoro,5-metilo, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 45

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa pentafluoro, R^3 significa metilo y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

25

PF 55127

31

Tabla 46

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

5

Tabla 47

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

10

Tabla 48

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

15

Tabla 49

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

20

Tabla 50

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

25

PF 55127

32

Tabla 51

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

5

Tabla 52

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

10

Tabla 53

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

15

Tabla 54

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,4,5-trifluoro, R^3 significa cloro y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 55

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

25

PF 55127

33

Tabla 56

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

5

Tabla 57

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

10

Tabla 58

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

15

Tabla 59

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

20

Tabla 60

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

25

Tabla 61

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

5

Tabla 62

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

10

Tabla 63

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,3,4-trifluoro, R³ significa cloro y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 64

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

20

Tabla 65

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

25

PF 55127

35

Tabla 66

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

5

Tabla 67

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

10

Tabla 68

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

15

Tabla 69

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

20

Tabla 70

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

25

PF 55127

36

Tabla 71

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

5

Tabla 72

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

10

Tabla 73

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

15

Tabla 74

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

20

Tabla 75

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

25

PF 55127

Tabla 76

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

5

Tabla 77

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

10

Tabla 78

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

15

Tabla 79

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

20

Tabla 80

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

25

PF 55127

38

Tabla 81

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

5

Tabla 82

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

10

Tabla 83

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

15

Tabla 84

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

20

Tabla 85

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

25

PF 55127

39

Tabla 86

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

5

Tabla 87

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

10

Tabla 88

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

15

Tabla 89

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

20

Tabla 90

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

25

PF 55127

Tabla 91

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

5

Tabla 92

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

10

Tabla 93

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,6-dicloro, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 94

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2-fluoro,6-metilo, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 95

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

25

PF 55127

41

Tabla 96

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

5

Tabla 97

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

10

Tabla 98

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

15

Tabla 99

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,4,5-trifluoro, R^3 significa metoxi y R^1 , R^2 corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

20

Tabla 100

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

25

PF 55127

42

Tabla 101

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

5

Tabla 102

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

10

Tabla 103

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

15

Tabla 104

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

20

Tabla 105

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

25

PF 55127

Tabla 106

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

5

Tabla 107

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,5-difluoro, R³ significa metoxi y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

10

Tabla 108

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

15

Tabla 109

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

20

Tabla 110

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

25

PF 55127

Tabla 111

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

5

Tabla 112

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

10

Tabla 113

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

15

Tabla 114

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

20

Tabla 115

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

25

PF 55127

Tabla 116

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

5

Tabla 117

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

10

Tabla 118

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

15

Tabla 119

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

20

Tabla 120

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

25

LM

PF 55127

Tabla 121

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

5

Tabla 122

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

10

Tabla 123

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

15

Tabla 124

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

20

Tabla 125

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

25

PF 55127

Tabla 126

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

5

Tabla 127

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

10

Tabla 128

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

15

Tabla 129

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

20

Tabla 130

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

25

PF 55127

Tabla 131

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

5

Tabla 132

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

10

Tabla 133

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

15

Tabla 134

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

20

Tabla 135

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

25

PF 55127

Tabla 136

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

5

Tabla 137

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

10

Tabla 138

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

15

Tabla 139

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

20

Tabla 140

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

25

Tabla 141

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

5

Tabla 142

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

10

Tabla 143

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

15

Tabla 144

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

20

Tabla 145

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

25

PF 55127

51

Tabla 146

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

5

Tabla 147

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

10

Tabla 148

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

15

Tabla 149

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

20

Tabla 150

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

25

PF 55127

52

Tabla 151

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

5

Tabla 152

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

10

Tabla 153

Compuestos de las fórmulas Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ii y Va, en los que L_n significa 2,3,4-trifluoro, R³ significa ciano y R¹, R² corresponden a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla A

15

Tabla 154

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

20

Tabla 155

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

25

PF 55127

Tabla 156

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

5

Tabla 157

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

10

Tabla 158

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

15

Tabla 159

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

20

Tabla 160

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

25

PF 55127

Tabla 161

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

5

Tabla 162

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

10

Tabla 163

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

15

Tabla 164

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

20

Tabla 165

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

25

PF 55127

55

Tabla 166

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

5

Tabla 167

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

10

Tabla 168

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

15

Tabla 169

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

20

Tabla 170

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

25

PF 55127

Tabla 171

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

5

Tabla 172

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

10

Tabla 173

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

15

Tabla 174

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

20

Tabla 175

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

25

PF 55127

57

Tabla 176

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

5

Tabla 177

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

10

Tabla 178

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

15

Tabla 179

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

20

Tabla 180

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

25

PF 55127

58

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
A-13	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CCl ₃	H
A-16	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-17	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-18	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-19	CH(CH ₃) ₂	H
A-20	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-21	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-22	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H
A-24	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-25	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-26	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A-27	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-28	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-30	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-31	(±) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H
A-33	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-34	(R) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-35	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	H

PF 55127

No.	R ¹	R ²
A-36	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₃
A-37	(S) CH(CH ₂ CH ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-38	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-39	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-40	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-43	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-45	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-47	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-48	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-49	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-52	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-54	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-56	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-57	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-58	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-61	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-63	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-66	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-67	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-70	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-71	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-72	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃

PF 55127

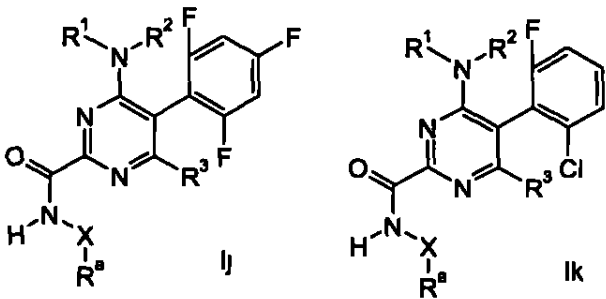
No.	R ¹	R ²
A-73	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-74	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-77	cilcopentilo	H
A-78	cilcopentilo	CH ₃
A-79	cilcopentilo	CH ₂ CH ₃
A-80	cilcohexilo	H
A-81	cilcohexilo	CH ₃
A-82	cilcohexilo	CH ₂ CH ₃
A-83	-(CH ₂) ₄ -	
A-84	(±) -(CH 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 -	
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) ₃ -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] ₂ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-100	(CH ₂) ₂ -  -CH ₂	
A-101	-(CH ₂) ₂ -C(O[CH ₂] ₃ O)-(CH ₂) ₂ -	
A-102	-(CH ₂) ₂ -CH=CH-CH ₂ -	

Además, son preferidos con respecto a su uso los compuestos I relacionados en las siguientes Tablas. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente representan, además, considerados por si solos, independientemente de la combinación en

PF 55127

61

que se mencionan, una variante especialmente preferida del correspondiente sustituyente.



5

Tabla 181

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que NR¹R² significan 4-metilpiperidina y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10

Tabla 182

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es CH(CH₃)₂, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15

Tabla 183

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ CH₂CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20

PF 55127

Tabla 184

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R,S) CH(CH₃)CH₂CH₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5

Tabla 185

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R) CH(CH₃)CH₂CH₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10

Tabla 186

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (S) CH(CH₃)CH₂CH₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15

Tabla 187

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R,S) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20

Tabla 188

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metilo y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

25

PF 55127

63

Tabla 189

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa metilo y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5

Tabla 190

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que NR^1R^2 es 4-metilpiperidina y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10 Tabla 191

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15 Tabla 192

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es CH_2CF_3 , R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20 Tabla 193

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

25

PF 55127

64

Tabla 194

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5

Tabla 195

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10

Tabla 196

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15

Tabla 197

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que es R^1 (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20

Tabla 198

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa cloro y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

25

PF 55127

65

Tabla 199

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que NR^1R^2 es 4-metilpiperidina y R^3 significa metoxi y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5 Tabla 200

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa metoxi y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10 Tabla 201

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es CH_2CF_3 , R^2 significa hidrógeno y R^3 significa metoxi y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15 Tabla 202

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R,S) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa metoxi y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20 Tabla 203

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R) $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa metoxi y $-\text{X}-\text{R}^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

PF 55127

66

Tabla 204

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (S) CH(CH₃)CH₂CH₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metoxi y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5

Tabla 205

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R,S) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metoxi y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10

Tabla 206

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metoxi y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15

Tabla 207

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (S) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa metoxi y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20

Tabla 208

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que NR¹R² es 4-metilpiperidina y R³ significa ciano y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

25

PF 55127

67

Tabla 209

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es $CH(CH_3)_2$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa ciano y $-X-R^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5

Tabla 210

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es CH_2CF_3 , R^2 significa hidrógeno y R^3 significa ciano y $-X-R^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10

Tabla 211

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R,S) $CH(CH_3)CH_2CH_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa ciano y $-X-R^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15

Tabla 212

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (R) $CH(CH_3)CH_2CH_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa ciano y $-X-R^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

20

Tabla 213

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R^1 es (S) $CH(CH_3)CH_2CH_3$, R^2 significa hidrógeno y R^3 significa ciano y $-X-R^a$ corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

25

PF 55127

Tabla 214

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R,S) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa ciano y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

5

Tabla 215

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (R) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa ciano y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

10

Tabla 216

Compuestos de las fórmulas Ij y Ik en los que R¹ es (S) CH(CH₃)CF₃, R² significa hidrógeno y R³ significa ciano y -X-R^a corresponde a un compuesto de cada vez una línea de la Tabla B

15

Tabla B

No.	X	R ^a
B-1	-(C=O)-	H
B-2		CH ₃
B-3		CH ₂ CH ₃
B-4		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-5		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-6		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-7	-O-	H
B-8		CH ₃
B-9		CH ₂ CH ₃
B-10		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-11		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-12		CH ₂ C(CH ₃) ₃

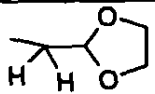
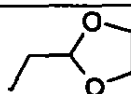
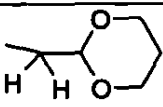
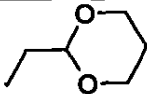
PF 55127

69

No.	X	R ^a
B-13	-(C=O)-O-	H
B-14		CH ₃
B-15		CH ₂ CH ₃
B-16		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-17		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-18		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-19	-NH-	H
B-20		CH ₃
B-21		CH ₂ CH ₃
B-22		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-23		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-24		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-25	-(C=O)-NH-	H
B-26		CH ₃
B-27		CH ₂ CH ₃
B-28		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-29		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-30		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-31	enlace directo	H
B-32		CH ₃
B-33		CH ₂ CH ₃
B-34		CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-35		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-36		CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-37		CH ₂ OH
B-38		CH ₂ CH ₂ OH
B-39		CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH
B-40		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH
B-41		CH ₂ OCH ₃
B-42		CH ₂ CH ₂ OCH ₃
B-43		CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃
B-44		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃
B-45		CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-46		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-47		CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-48		CH ₂ NH ₂
B-49		CH ₂ CH ₂ NH ₂
B-50		CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂

PF 55127

70

No.	X	R ^a
B-51		CH_2NHCH_3
B-52		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$
B-53		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$
B-54		$\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$
B-55		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$
B-56		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$
B-57		$\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
B-58		CH_2SH
B-59		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SH}$
B-60		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SH}$
B-61		CH_2SCH_3
B-62		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$
B-63		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$
B-64		$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$
B-65		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$
B-66		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$
B-67		$\text{CH}(\text{OCH}_3)_2$
B-68		$\text{CH}_2\text{CH}(\text{OCH}_3)_2$
B-69		$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{OCH}_3)_2$
B-70		
B-71		
B-72		
B-73		
B-74		
B-75		
B-76		$\text{CH}=\text{CH}_2$
B-77		$\text{CH}=\text{CH}_2\text{CH}_3$
B-78		$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$

PF 55127

No.	X	R ^a
B-79		CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂
B-80		CH ₂ C≡CH
B-81		CH ₂ CH ₂ C≡CH

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*, *oomicetos* 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, pasto, plátanos, al-
godón, soya, café, caña de azúcar, vid, frutas y plantas de adorno y legumbres, tales
10 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,
 - 15 • especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
 - *Blumeria graminis* (oídio) en cereales,
 - *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
 - *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
 - especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
 - 20 • especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
 - *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
 - *Plasmopara viticola* en vid,
 - *Podosphaera leucotricha* en manzanas,

PF 55127

72

- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales,
- *Pyricularia oryzae* en arroz,
- 5 • especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- *Uncinula necator* en vid,
- especies de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, así como
- especies de *Venturia*-Arten (roña) en manzanas y peras.

10

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

- 15 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

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

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

25

PF 55127

73

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

En la protección de materiales o de productos almacenados, la cantidad de aplicación
5 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.

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

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

20 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, gamma-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grasos y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de

PF 55127

74

disolventes,

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

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

PF 55127

75

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

5

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

Los granulados (p.ej granulados recubiertos, impregnados o homogéneos) se pueden
10 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
15 vegetales, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras de nueces, polvos de celulosa u otros soportes sólidos.

Generalmente, las formulaciones contienen entre 0,01 y 95% en peso, preferentemen-te, entre 0,1 y 90% en peso del principio activo. Los principios activos se usan en una
20 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

PF 55127

76

A) Concentrados solubles en agua (SL)

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 auxilia-
5 res. El ingrediente activo se disuelve cuando es diluido con agua

B) Concentrados dispersables (DC)

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

C)) Concentrados emulsionables (EC)

15 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)

20

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 (Ultraturrax) y transformada en una emulsión homogénea Diluyendo con agua, se obtiene una emul-

PF 55127

77

sión.

E) Suspensiones (SC, OD)

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

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

- 50 partes en peso de los principios activos son molidas finamente, 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
- 15

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

- 20 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 una dispersión o solución estable con el principio activo.

2 Productos para la aplicación directa

PF 55127

78

H) Polvos pulverizables (DP)

5 partes en peso de los principios activos son molidas finamente y mezcladas íntimamente con 95% de un caolín finamente dividido. Se obtiene un polvo pulverizable

5

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

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

10 fluidizado Se obtienen granulados que pueden ser aplicados sin dilución

J) Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

10 partes en peso de los principios activos son disueltas en un disolvente orgánico, por

15 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 direc-

20 tamente pulverizables, pastas, polvos pulverizables, agente de rociado o de regado

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

PF 55127

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

10 Las concentraciones en principio activo en las preparaciones listas para el uso pueden variar ampliamente. En general, varían de 0,0001 a 10%, preferentemente, de 0,01 a 1%.

Los principios activos también pueden ser usado con éxito en el procedimiento de volumen ultrabajo (ULV), pudiéndose aplicar formulaciones con más del 95% en peso de
15 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
20 pueden ser mezclados con los agentes según la invención en una relación ponderal de 1:10 hasta 10:1.

Cuando se usan como fungicidas, los fungicidas de la invención pueden estar presentes también junto con otros ingredientes activos, por ejemplo, con herbicidas, insectici-
25

PF 55127

das, reguladores del crecimiento, fungicidas u otros fertilizantes. Cuando se mezclan los compuestos l o las composiciones según la invención como fungicidas con otros fungicidas, entonces se alcanza, frecuentemente, ampliar el espectro de acción

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

- acilalaninas, tales como Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- 10 • derivados de amina, tales como Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
- anilínopirimidinas, tales como Pyrimethanil, Mepanipyrim o Cyrodinyl,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomicina,
- 15 • azoles, tales como Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinistroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalilo, Metconazol, Myclobutanyl, Penconazol, Propiconazol, Procloraz, Protoconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 20 • dicarboximidas, tales como Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- ditiocarbamatos, tales como Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, polycarbamato, Thiram, Ziram, Zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, Benomilo, Boscalid, Carbendazim, carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Ditanona, Famoxadon, Fenamidon,
- 25 Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanilo, Furametpir, Isoprotilan, Mepronilo,

PF 55127

81

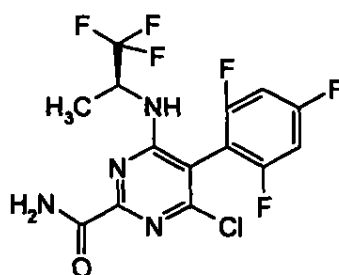
- Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, pirfenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Siltiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Tiofanato-metilo, Tiadinyl, Tricyclazol, Triforine,
- fungicidas de cobre, tales como caldo de burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,
- 5 • derivados de nitrofenilo, tales como Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles, tales como Fenpiclonyl o Fludioxonyl,
 - azufre,
 - otros fungicidas, tales como Acibencenoar-S-metilo, Benthiavalicarb, Carpropamid,
- 10 clorothalonilo, Cyflufenamid, Cymoxanilo, Dazomet, diclomezin, diclocymet, dieto-fencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Ferhexamid, Fentin-acetato, Fenoxanyl, Ferim-zone, Fluazinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, Iprovalicarb, hexaclorobenceno, Metra-fenon, Pencycuron, Propamocarb, ftalida, Toloclofos-metilo, Quintozene, Zoxamid,
- estrobilurinas, tales como Azoxistrobina, Dimoxistrobina, Fluoxastrobina, Kresoxim-
- 15 metilo, Metominostrobin, Orysastrobina, Picoxistrobina, Pyraclostrobina o Tri-floxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico, tales como Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolilfluanid,
 - amidas de ácido cinámico y análogos, tales como Dimetomorph, Flumetover o
- 20 Flumorph.

Ejemplos de síntesis

- Ejemplo 1: Preparación de 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metil-etilamino)-5-(2,4,6-
- 25 trifluoro-fenil)-pirimidin-2-carboxamida [1-5]

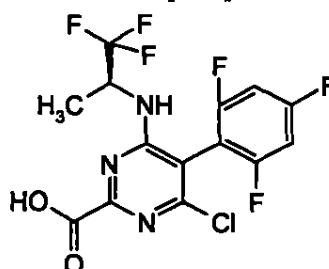
PF 55127

82



Se presentaron 5,0 g de 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metil-etilamino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pirimidin-2-carbonitrilo (ver WO 03/04993, páginas 28 y 29) en 5 ml de DMSO, se agregaron 344 mg de K_2CO_3 y se enfrió a 10°C. A continuación, se adicionaron 1,4 ml H_2O_2 al 30%. Se agitó 5 min. en el baño de hielo y luego todavía 30 minutos a temperatura ambiente. Entonces se introdujo la mezcla de reacción en 150 ml de agua, precipitándose la amida. La amida fue filtrada, lavada y secada en alto vacío, Se obtuvieron 4,7 g del compuesto indicado en el título de color beige del p f.. 157-162°C

10 Ejemplo 2. Preparación de ácido 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metil-etilamino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pirimidin-2-carboxílico [I-11]



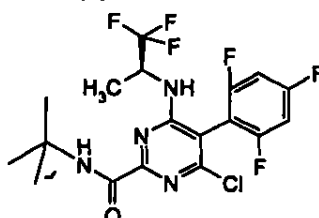
Se disolvieron 1,5 g de 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metil-etilamino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pirimidin-2-carbonitrilo (ver WO 03/04993, páginas 28 y 29) en 5 ml de H_2SO_4 concentrado y se agitó 20 min a 110°C. La mezcla de reacción se introdujo en 100 ml de agua helada, precipitándose el ácido. El ácido fue filtrado, lavado con agua y secado en alto vacío. Se obtuvieron 1,5 g del compuesto indicado en el título de color amarillo.

PF 55127

83

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , ppm): 1.4 (d, CH_3), 4.85 (d, NH), 5.60-5.80 (m, CH), 6.90-7.00 (m, CH), 10.5 (s (ancho), OH)

Ejemplo 3 Preparación de N-terc.-butilamida de ácido 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metil-etilamino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pinmidin-2-carboxílico [I-10]

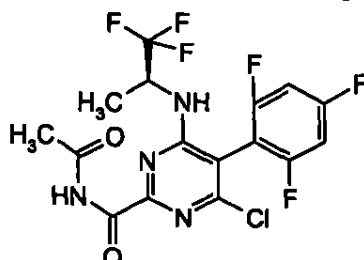


- a) A 5 ml de cloruro de tionilo de 40 °C se agregaron 1,5 g del ácido (Ejemplo 2). La mezcla de reacción se agitó hasta terminado el desarrollo de gas. Entonces se mezcló la preparación con tolueno y se destiló completamente el disolvente y cloruro de tionilo excesivo. Se obtuvieron 1,6 g de un aceite de color verde oscuro.
- b) Se presentaron 38 mg de terc.-butilamina y 58 mg de trietilamina en 7 ml de THF a 0°C y se agregaron 200 mg del cloruro de ácido previamente preparado, disuelto en 2 ml de THF. La mezcla de reacción se agitó ulteriormente durante 12 horas a temperatura ambiente. Luego se concentró la mezcla de reacción por rotación, se absorbió en éter metil-ter.-butílico y se lavó con agua. La fase orgánica se separó, se secó sobre MgSO_4 y se concentró. El producto crudo se purificó mediante HPLC preparativa. Se obtuvieron 21 mg del compuesto del título amarillo con un p.f. de 49-54°C

PF 55127

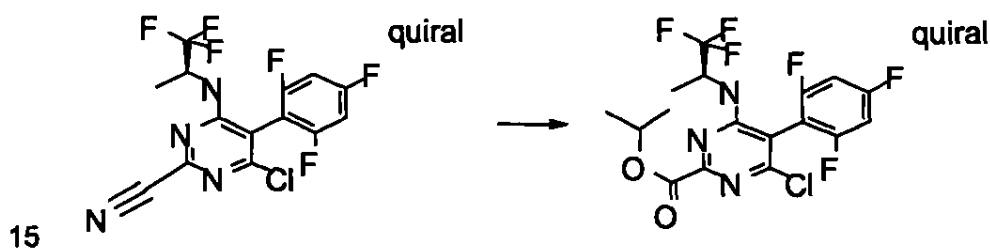
84

Ejemplo 4: Preparación de N-acetilamida de ácido 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metiletilamino)-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-pirimidin-2-carboxílico [I-12]



Se hicieron reaccionar 150 mg de amida (Ejemplo 1) en 10 ml de THF junto con 20 mg
 5 de hidruro sódico bajo enfriamiento de baño de hielo y se agitó posteriormente durante
 30 min. Entonces se agregaron lentamente 35 mg de cloruro de ácido acético disuelto
 en 1 ml de THF. Se agitó 30 min a temperatura ambiente y luego se mezcló la mezcla
 de reacción con agua helada y se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas re-
 unidas se secaron sobre Mg_2SO_4 y se concentraron por rotación. Se obtuvieron 65 mg
 10 del compuesto indicado en el título de color pardo rojizo con p f de 58 a 65°C

Ejemplo 5: Preparación de 4-cloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-metiletilamino)-5-(2,4,6-trifluorofenil)-pirimidin-2-carboxilato de isopropilo - [V-3]



En 210 ml de iso-propanol se disolvieron a temperatura ambiente 22 g de 4-cloro-6-
 ((S)-2,2,2-trifluoro-1-metiletilamino)-5-(2,4,6-trifluorofenil)-pirimidin-2-carbonitrilo. En
 esta solución se introdujeron durante 30 min gas HCl y se agitó 96 h a reflujo. La pre-
 20 paración se concentró, se mezcló con agua, se cubrió con éster acético y se reguló

PF 55127

85

con carbonato de sodio a un pH alcalino. La fase de éster acético se secó con sulfato de magnesio y se concentró por rotación. Se obtuvieron 21,4g de un sólido incoloro.

Rendimiento: 83,8%

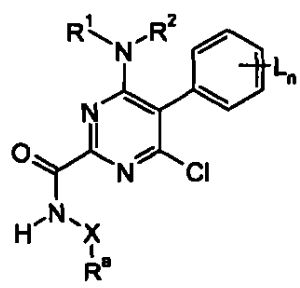
p f . 146-147°C

5

Las prescripciones indicadas en los ejemplos de síntesis arriba descritos se aplicaron variando en forma correspondiente los compuestos de partida, para la generación de otros compuestos I. Los compuestos así obtenidos se indican en la siguiente Tabla I con sus datos físicos

10

Tabla IA

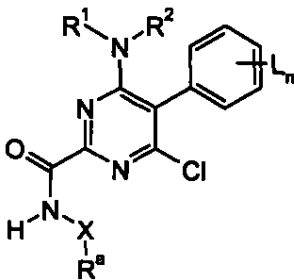


15

PF 55127

86

Tabla IA



IA

No.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	p.f. [°C]	¹ H-NMR [CD-Cl ₃ , ppm]
I-1	H	(R,S)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2,4,6-trifluoro		0.80-0.90 (m, 2CH ₃), 1.15 (d, CH ₅), 1.75-1.85 (m, CH), 4.25-4.30 (m, CH), 4.60 (s, NH), 6.75 (s, NH), 6.80-6.90 (m, 2CH), 7.70 (s, NH)
I-2	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2,4,6-trifluoro	116-128	
I-3	H	-CH(CH ₃) ₂	H	2-cloro-6-fluoro	208-210	
I-4	NH ₂	-CH(CH ₃) ₂	H	2-cloro-6-fluoro	103-108	
I-5	H	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro	157-162	
I-6	NH ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro	59-65	
I-7	H	-CH ₂ C=CH ₂	CH ₂ C=CH ₂	2,4,6-trifluoro	134-141	
I-8	CH ₃	-CH ₂ C=CH ₂	CH ₂ C=CH ₂	2,4,6-trifluoro	52-58	
I-9	-N(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro	39-45	
I-10	-C(CH ₃) ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-	49-	

PF 55127

No.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	p.f. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
				trifluoro	54	
I-11	-OH	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.4(d, CH ₃), 4.85 (d, NH), 5.60-5.80 (m, CH), 6.90-7.00 (m, CH), 10.5 (s(breit), OH)
I-12	(C=O)CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	58- 65	
I-13	H	-CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	222- 224	
I-14	-CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.25 (d, 3H), 2.9 (d, 3H), 5.25 (m, 2H), 6.75 (m, 2H), 7.8 (s, 1H)
I-15	H	-CH ₂ -COOH	H	2,4,6- trifluoro	227- 228	
I-16	H	(R)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2,4,6- trifluoro		0.75 (m, 6 H), 1.1 (m, 3H), 1.75 (m, 1H), 4.2 (m, 1H), 4.4 (m, 1H), 5.8 (s, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.4 (m, 1H), 7.6 (s, 1H)
I-17	H	-CH(CH ₃) ₂	H	2-cloro- 4-fluoro	141- 150	
I-18	H	-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	2-cloro- 4-fluoro	48- 56	
I-19	H	(R)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2, 4- difluoro		0.75 (m, 6 H), 1.1 (m, 3H), 1.75 (m, 1H), 4.2 (m, 1H), 4.5 (m, 1H),

PF 55127

88

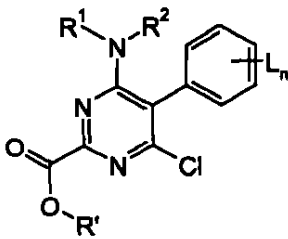
No.	R ³ X	R ¹	R ²	L _n	p.f. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
						5.85 (s, 1H), 7.1 (m, 2H), 7.3 (m, 1H), 7.6 (s, 1H)
I-20	H	-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	2, 4- difluoro	53- 58	
I-21	H	-CH(CH ₃) ₂	H	2, 4- difluoro	172- 176	
I-22	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2, 4- difluoro	50- 63	
I-23	H	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2, 4- difluoro	99- 105	
I-24	H	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2-cloro- 4-fluoro	79- 88	
I-25	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2, 6- difluoro	173- 175	
I-26	H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2-cloro- 4-fluoro	175- 177	
I-27	H	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2, 6- difluoro	206- 208	
I-28	H	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2, 6- difluoro	128- 130	
I-29	H	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2-cloro- 4-fluoro	165- 167	
I-30	(C=O)CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2-cloro- 4-fluoro		0.9 (d, 3H), 1.0 (m, 2H), 2.6 (s, 3H), 4.0 (m, 2H), 7.1 (m, 1H), 7.25 (m, 2H), 10.0 (s, 1H)
I-31	H	(S)- CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	2-cloro- 4- metoxi	84- 88	

PF 55127

89

No.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	p.f. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
I-32	H	(S)-CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.4 (m, 3 H), 3.9 (s, 3 H), 5.0 (d, 1H), 5.25 (m, 1H), 6.8 (m, 2H)
I-33	(C=O)CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2, 6- difluoro		0.9 (d, 3H), 1.0 (m, 2H), 1.6 (s, 3H), 2.8 (s, 3H), 4.0 (m, 2H), 7.0 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 10.0 (s, 1H)

Tabla VA



PF 55127

90

No.	R'	R'	R ²	L _n	p.f. [°C]	¹ H-NMR [CDCl ₃ , ppm]
V-1	CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.3 (d, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.6 (d, NH), 5.25 (m, 1H), 6.9 (m, 2H)
V-2	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ C=CH ₂	- CH ₂ C=CH ₂	2,4,6- trifluoro	53- 57	
V-3	-CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	146- 147	
V-4	-CH ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.35 (d, 3H), 1.45 (t, 3H), 4.5 (q, 2H), 4.6 (d, NH), 5.3 (m, CH), 6.9 (m, 2H)
V-5	-(CH ₂) ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	100- 105	
V-6	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	115- 118	
V-7	-(CH ₂) ₃ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	71- 75	
V-8	-(CH ₂) ₄ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	82- 88	
V-9	-(CH ₂) ₅ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	57- 60	
V-10	-CH ₂ CF ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.35 (d, 3H), 4.7 (d, NH), 4.8 (m, 2H), 5.3 (m, 1H), 6.9 (m, 2H)
V-11	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	90- 93	
V-12	-CH ₂ CH(CH ₃)- CH ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro	75- 81	

PF 55127

91

No.	R ^a X	R ¹	R ²	L _n	p.f. [°C]	¹ H-NMR [CD- Cl ₃ , ppm]
V-13	-CH(CH ₃)- (CH ₂) ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃		2,4,6- trifluoro		0.9 (t, 3H), 1.3- 1.9 (m, 13H), 4.55 (d, NH), 5.25 (m, 2H), 6.9 (m, 2H)
V-14	-CH(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2,4,6- trifluoro		0.8 (d, 3H), 0.9 (m, 2H), 1.4 (d, 6H), 1.5 (m, 3H), 2.7 (t, 2H), 3.9 (d, 2H), 5.2 (m, CH), 6.7 (m, 2H)
V-15	-CH(CH ₃)- CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.0 (m, 6H), 1.4 (m 6H), 2.0 (m, CH), 4.6 (m, NH), 5.0 (m, CH), 5.3 (m, CH), 6.9 (m, 2H)
V-16	-CH ₂ C=CH ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.35 (d, 3H), 4.8 (d, 2H), 4.95 (d, 1H), 6.3 (m, 2H), 5.45 (d, 1H), 6.1 (m, 1H), 6.9 (m, 1H)
V-17	-(CH ₂) ₂ NH ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.0 (m, 6H), 1.4 (m 6H), 2.0 (m, CH), 4.6 (m, NH), 5.0 (m, CH), 5.3 (m, CH), 6.9 (m, 2H)
V-18	alcohexilo	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6- trifluoro		1.35 (d, 3H), 4.8 (d, 2H), 4.95 (d, 1H), 6.3 (m, 2H), 5.45 (d,

PF 55127

						1H), 6.1 (m, 1H), 6.9 (m, 1H)
V-19	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro	97-102	
V-20	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	(S) -CH(CH ₃)CF ₃ -	H	2,4,6-trifluoro	145-146	
V-21	-CH ₂ C ₆ H ₅	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro		1.4 (d, 3H), 4.55 (m, 3H), 5.25 (m, 1H), 6.9 (m, 2H), 7.3-7.5 (m, 5H)
V-22	cilcopentilo	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro	114-115	
V-23	cilcobutilo	(S) -CH(CH ₃)CF ₃	H	2,4,6-trifluoro	127-129	

Ejemplos del efecto contra hongos nocivos

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

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

10

PF 55127

Ejemplos de aplicación

1. Efecto contra el mildiú en tomates causado por *Phytophthora infestans* en el
- 5 tratamiento protector

Las hojas de plantas de tomate de la variedad "goldene Prinzessin" se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa en la concentración en principio activo abajo indicada. Al día siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de

10 zoosporas de *Phytophthora infestans*. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 18 y 20°C. Después de 6 días, el mildiú se había desarrollado tan fuertemente en las plantas de control no tratadas pero infectada, que se pudo evaluar la infestación visualmente en por cien.

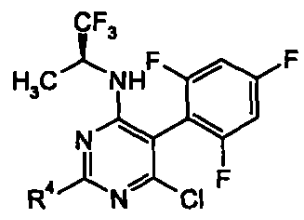
C[C@H](C(F)(F)F)N1C=NC2=C(C(=C1)C(=CC=C2C(F)=C(F)F)Cl)N=C(R4)N2

No.	R ⁴	Dokumento	Infección con 250 ppm de i.a. (%de superficie de hoja)
I-5	-(C=O)NH ₂	según la invención	0
V1	- (C=NOCH ₃)NH ₂	WO 03/043993	80
	no tratado		80

15

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

Las hojas de plantas de tomate de la variedad "Goldene Prinzessin" se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa en la concentración en principio activo abajo indicada. Para examinar el efecto duradero se infectaron las hojas recién siete días más tarde con una suspensión acuosa de zoosporas de *Alternaria solani* en 2 % de solución de biomalta con una densidad de 0.17×10^6 de esporas/ml. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 20 y 22°C. Al cabo de otros cinco días se había desarrollado la enfermedad tan fuertemente en las plantas de control no tratadas pero infectadas, que se podía evaluar la infestación visualmente en por cien

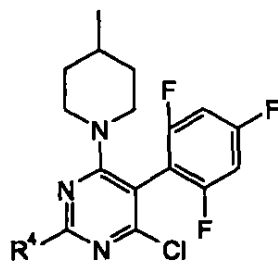


No.	R ⁴	Dokumento	Infección con 16 ppm de l.a. (%de superficle de hoja)
I-5	(C=O)NH ₂	según la invención	30
V1	(C=NOCH ₃)NH ₂	WO 03/043993	67
	no tratado		90

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

PF 55127

Plántulas de pimiento de la variedad "Neusiedler Ideal Elite" fueron pulverizadas hasta chorrear, después de que se habían desarrollado bien 4 a 5 hojas, con una suspensión acuosa con la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente, se inocularon las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea*, que
5 contenía $1,7 \times 10^6$ esporas/ml en una solución acuosa al 2% de biomalta. A continuación, se colocaron las plantas de ensayo en una cámara climática con 22 a 24°C y alta humedad del aire. Después de 5 días se podía determinar visualmente la extensión de la infestación por el hongo en %.



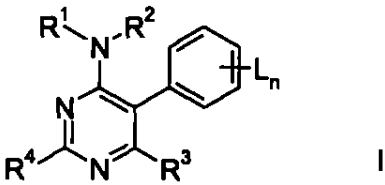
No.	R ⁴	Dokumento	Infección con 16 ppm de i.a. (%de superficie de hoja)
I-2	-(C=O)NH ₂	según la invención	15
V2	- (C=NOCH ₃)NH ₂	Ejemplo I-186 de la WO 03/043993	90
		no tratado	100

PF 55127

96

Reivindicaciones

1. Pírimidinas 2-sustituidas de la fórmula I



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

n es un número entero de 1 a 5,

10

L es halógeno, ciano, cianato (OCN), alquilo C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, -alcoxi C₁-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, cilcoalquilo C₃-C₈, cilcoalquenilo C₄-C₈, cilcoalquiloxi C₃-C₈, cilcoalqueniloxi C₄-C₈, nitró, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A,

15

m es 0, 1 ó 2,

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, cilcoalquilo C₃-C₈, cilcoalquenilo C₃-C₈, fenilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por nitró, cianato, ciano o alcoxi C₁-C₄, o

20

PF 55127

97

pudiendo A y A' formar juntos con los átomos a los que están ligados un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

5

pudiendo los grupos alifáticos de las demás definiciones de L estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u:

10 R^u significa ciano, alcoxi C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₈, alquinoxio C₂-C₈, cicloalqueno C₄-C₈, cicloalquinoxio C₃-C₈, cicloalquinoxio 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, alquilo 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 R^v:

20 R^v ciano, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₄-C₈, hidroxio, alcoxi C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, alquinoxio C₂-C₈, cicloalquinoxio C₃-C₈, cicloalquinoxio C₄-C₈, alquilo C₁-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 radicales seleccionados del grupo halógeno, alquilo C₁-C₈, alqueno C₂-C₈, al-

25

quinilo 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,

R² puede significar, adicionalmente, hidrógeno;

5

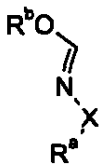
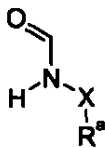
R¹ y R² pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter-(O-), carbonilo -(C=O), tio -(S-), sulfoxilo -(S[=O]-) o sulfenilo -(SO₂-) o un grupo amino -(N(R^a)) adicional, donde R^a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

10

R³ es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₃-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 alcoxycarbonilo C₁-C₄,

15

20 R⁴ corresponde a una de las fórmulas



donde

PF 55127

99

- X significa un enlace directo, $-(C=O)$, $-(C=O)-NH$, $-(C=O)-O$, $-O$, $-NR^c$, $-CH_2-O-(C=O)$, $-C=C-(C=O)$, estando cada vez el átomo izquierdo del miembro de puente ligado con el átomo de nitrógeno;
- 5 R^a significa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 o bencilo;
- R^b es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6
- 10 R^c es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , bencilo o acilo C_1-C_6
- puediendo los grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos de las definiciones de los radicales de R^a , R^b y/o R^c a su vez llevar uno a cuatro grupos R^w
- 15 R^w significa halógeno, ciano, OR^x , NHR^x , SR^x , alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxicarbonilo C_1-C_4 , acilamino C_1-C_4 , [1,3]dioxolanoalquilo- C_1-C_4 , [1,3]dioxano -alquilo- C_1-C_4 , donde
- R^x significa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-
- 20 C_6 o bencilo.

2. Pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula I según la reivindicación 1, donde el índice y los sustituyentes tienen los significados siguientes:

PF 55127

100

n es un número entero de n 1 a 3, encontrándose por lo menos un sustituyente L en la posición orto en el anillo fenilo,

L significa halógeno, ciano, metilo, metoxi, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$,
5 $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$,

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

10

pudiendo los grupos alifáticos de las definiciones de los radicales de L a su vez estar parcial o completamente halogenados;

15

R^1, R^2 significan, independientemente, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , halógenoalquenilo C_2-C_6 o halógenoalquinilo C_2-C_6 ;

20

R^2 puede significar, adicionalmente, hidrógeno;

R^1 y R^2 también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo saturado o insaturado de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter $(-O-)$ u otro grupo amino $(-$

25

PF 55127

101

N(R^a) adicional, significando R^a hidrógeno o alquilo C₁-C₆, y/o contener uno o varios sustituyenes del grupo halógeno, alquilo C₁-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆ y oxi -alquilenoxi-C₁-C₃.

5 R³ significa halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄;

R⁴ corresponde a una de las fórmulas



10 donde

X significa un enlace directo, -(C=O)-, -(C=O)-NH-, -(C=O)-O-, -O-, -NR^c-, estando la parte izquierda de la molécula cada vez ligada con el átomo de nitrógeno,

15

R^a significa hidrógeno, metilo, alilo o propargilo;

R^b significa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alilo o propargilo,

20

R^c significa hidrógeno, metilo o acilo C₁-C₄

PF 55127

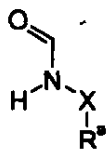
pudiendo los grupos alifáticos de las definiciones de los radicales R^a, R^b y/o R^c a su vez llevar uno o dos grupos R^w:

5 R^w significa halógeno, OR^x, NHR^x, alquilo C₁-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₄, acilamino C₁-C₄, [1,3]dioxolano-C₁-C₄-alquilo, [1,3]dioxano-C₁-C₄-alquilo, donde

R^x significa hidrógeno, metilo, alilo o propargilo

10 3. Pirimidinas 2-sustituidas según la reivindicación 1, donde R³ es cloro, ciano, metilo o metoxi.

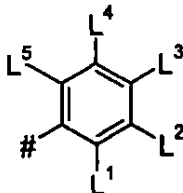
4. Pirimidinas 2-sustituidas según la reivindicación 1, donde R⁴ corresponde a una fórmula



15 en la que X es un enlace directo -O- o -(C=O)-O-, y R⁵ significa hidrógeno o alquilo C₁-C₈.

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

20



B

PF 55127

103

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

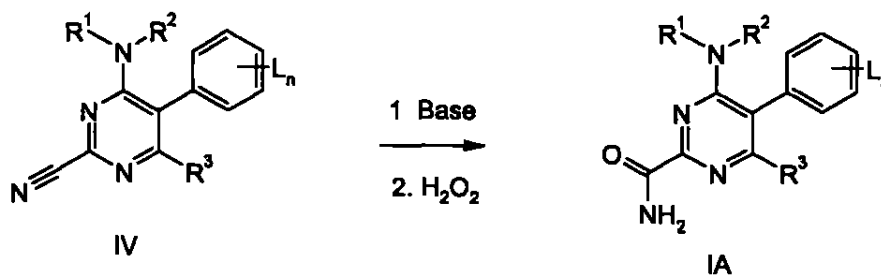
L^1 significa flúor, cloro, CH_3 o CF_3 ;

L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno, CH_3 o flúor;

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

L^5 significa hidrógeno, flúor, cloro o CH_3

10 6. Procedimiento para la obtención de los compuestos IA, por hidrólisis



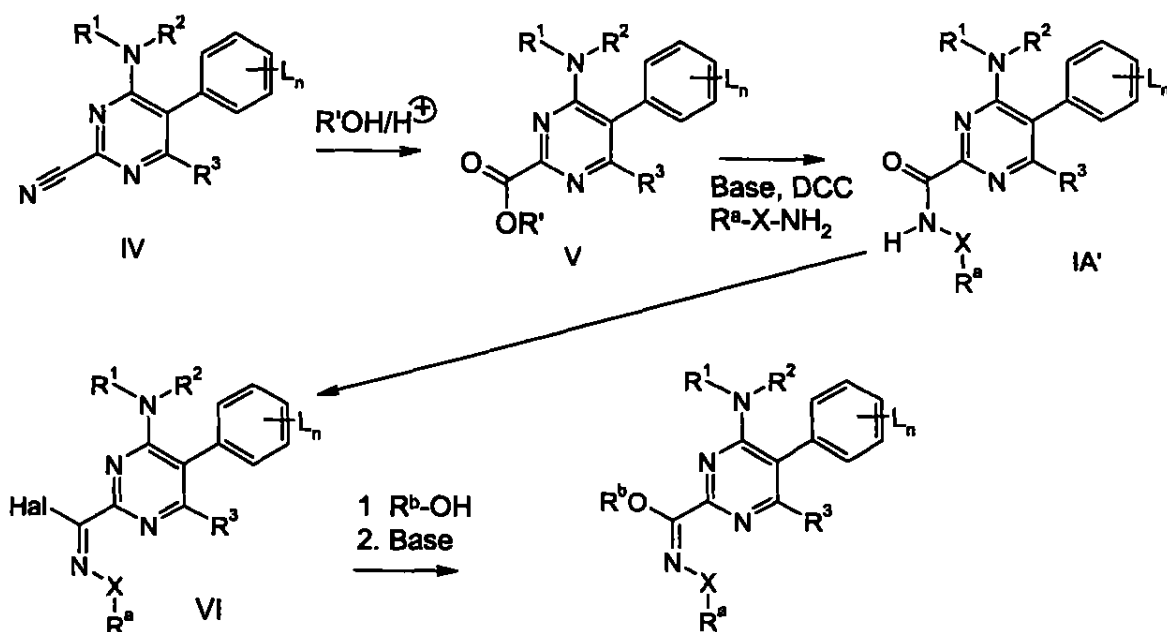
de los nitrilos de la fórmula IV, donde los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y L , así como el índice n tienen los significados indicados en la reivindicación 1, caracterizado porque se hidroliza en presencia de una base y peróxido de hidrógeno

15

7. Procedimiento para la obtención de los compuestos según la invención IA' y IC, donde los sustituyentes L_n , R^1 , R^2 , R^3 , X , R^a y R^b tienen los significados indicados en la reivindicación 1, partiendo de nitrilos de la fórmula IV,

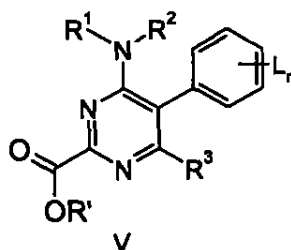
PF 55127

104



que se transforman con alcoholes de la fórmula $R'OH$, donde R' significa alquilo C_1-C_8 , alquenoilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 o hidroalquilo C_3-C_8 , cuyos radicales alquilo, alquenoilo y alquinilo pueden estar parcial o completamente halogenados y llevar uno a tres grupos R^v , en los ésteres de la fórmula V, y luego se transforman con aminas R^a-X-NH_2 bajo adición de agentes deshidratantes, en las amidas IA', y entonces se transforman en presencia de tetracloruro de carbono y triarilfosfina en los iminohaluros de la fórmula VI, y finalmente, se transforman con alcoholes de la fórmula R^bOH y bases en los imino éteres de la fórmula IC.

8 Ésteres de la fórmula V



PF 55127

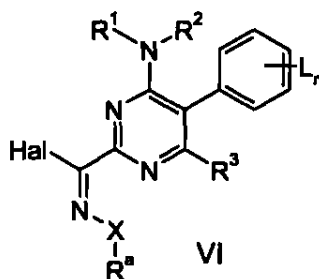
105

en la que los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y L_n tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y R' significa alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 o hidroalquilo C_3-C_8 , cuyos radicales alquilo, alquenilo, alquinilo pueden estar parcial o completamente halogenados y llevar uno a tres grupos R'' .

5

9. Ésteres V según la reivindicación 8, donde R' significa isopropilo.

10 Iminohaluros de la fórmula IV



10

donde los sustituyentes L_n , R^1 , R^2 , R^3 , X y R^a tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y Hal significa flúor, cloro, bromo o yodo.

11. Producto pesticida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

15

12. Producto pesticida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula V según una de las reivindicaciones 7 ó 8.

20 13 Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado por que se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a pro-

PF 55127

106

teger frente a la infección por los hongos, con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

- 14
- 5
- Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado por que se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a la infección por los hongos, con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula V según una de las reivindicaciones 7 ó 8.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(22)

International Application No
PCT/EP2004/007877A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D239/42

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

B FIELDS SEARCHED

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

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data

C DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
A	WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30 May 2003 (2003-05-30) cited in the application page 1, line 4 - line 5 Seite 1, Formel I page 2, line 46 page 17, line 36 - page 19, line 4 Seite 30 - 50, Beispiele	1-9
A	WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM ; BASF AG (DE); GEWEHR MARKUS (DE); LORENZ GISELA) 26 September 2002 (2002-09-26) cited in the application page 1, line 2 - line 3 Seite 1, Formel I page 24, line 14 - page 25, line 9 Seite 35 - 44, Beispiele	1-9

☐ Further documents are listed in the continuation of box C☒ Patent family members are listed in annex

* Special categories of cited documents

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier document but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 November 2004

Date of mailing of the international search report

23/11/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P B 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hoepfner, W

3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
EP2004/007877

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03043993	A	30-05-2003	CA 2467683 A1	30-05-2003
			WO 03043993 A1	30-05-2003
			EP 1448532 A1	25-08-2004
WO 02074753	A	26-09-2002	BG 108174 A	30-09-2004
			BR 0207975 A	15-06-2004
			CA 2440405 A1	26-09-2002
			CZ 20032475 A3	17-12-2003
			EE 200300448 A	16-02-2004
			WO 02074753 A2	26-09-2002
			EP 1373222 A2	02-01-2004
			HU 0400210 A2	30-08-2004
			JP 2004525133 T	19-08-2004
			SK 11422003 A3	06-04-2004
			US 2004116429 A1	17-06-2004

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D239/42

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

B RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitrag Anspruch Nr.
A	WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30. Mai 2003 (2003-05-30) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 4 - Zeile 5 Seite 1, Formel I Seite 2, Zeile 46 Seite 17, Zeile 36 - Seite 19, Zeile 4 Seite 30 - 50, Beispiele	1-9
A	WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM ; BASF AG (DE); GEWEHR MARKUS (DE); LORENZ GISELA) 26. September 2002 (2002-09-26) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 2 - Zeile 3 Seite 1, Formel I Seite 24, Zeile 14 - Seite 25, Zeile 9 Seite 35 - 44, Beispiele	1-9

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

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

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

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

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

15. November 2004

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

23/11/2004

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P B 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Hoepfner, W

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichung, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

P P2004/007877

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03043993 A	30-05-2003	CA 2467683 A1	30-05-2003
		WO 03043993 A1	30-05-2003
		EP 1448532 A1	25-08-2004
WO 02074753 A	26-09-2002	BG 108174 A	30-09-2004
		BR 0207975 A	15-06-2004
		CA 2440405 A1	26-09-2002
		CZ 20032475 A3	17-12-2003
		EE 200300448 A	16-02-2004
		WO 02074753 A2	26-09-2002
		EP 1373222 A2	02-01-2004
		HU 0400210 A2	30-08-2004
		JP 2004525133 T	19-08-2004
		SK 11422003 A3	06-04-2004
		US 2004116429 A1	17-06-2004

Relativo Folio 174
-Excluded

Expediente No		06-006393	No de Folio
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	X	7
10	OTROS		✓

Observaciones: El sobre contiene un arte grafico

175

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : ES306393 020306320
Fecha (REC): 2006-01-24 17:11:46
Tramite : 011 PCT-PATENT 378 FASE HACI 411 PRESENTAC
Referencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 176

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 4,665
FECHA : ENERO 23 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	36494409	23/01/2006	36,366,160.00

***** CONCEPTO *****

CONT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	\$ 463,000.00

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 00361-841-0744



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Radicación : 06005393 03000220
Fecha (AMS) : 2006-01-24 17:11:49
Trámite : 011 PCT-PATENT 378 FASE INCI 411 PRESENTAR
Dependencia : 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 176

177
176

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

177

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 178

2020
Bogotá D.C.,

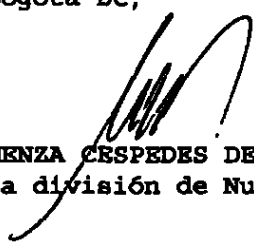
Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	06 6393
	Solicitud internacional	EP2004/007877
	Fecha inicio fase nacional	24/02/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	364
	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 ABR. 2006


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa11