

Q.F



**Industria y Comercio**

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

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

**PCT**

SOLICITUD

**PATENTE DE INVENCION**

21 EXPEDIENTE No.

06-59315

54 TÍTULO

6-(AMINOCARBONIL-FENIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS,

PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y SU USO

PARA EL COMBATE DE HONGOS DAÑINOS, ASI COMO

AGENTES QUE LAS CONTIENEN

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71 SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74 APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22 BOGOTÁ, D. C.,



**Industria y Comercio**  
SUPERINTENDENCIA

**PETITORIO**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 06-059315-00000-0000

Fee: 2035-05-18 17:57:11 Dep: 2020 NUECREACIONES

Ti: 11 PATENTE.Y.

Ex: 379 FASE NACIONAL

Act: 411 PRESENTACION

Folios: 178

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

**SOLICITUD DE:**

1

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☐ Capítulo I.

☒ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE  
(71)**

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

Dirección: 67056 Ludwigshafen,  
República Federal de Alemania

Domicilio: Ludwigshafen,  
República Federal de Alemania

**IDENTIFICACIÓN**

C.C. ☐ NIT ☐  
C.E. ☐ Otro ☐  
Cual \_\_\_\_\_  
Número \_\_\_\_\_

3

**REPRESENTANTE  
O APODERADO**

Nombre: **EMILIO FERRERO**  
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35  
Teléfono: 347 36 11  
Fax: 211 88 50  
E-mail: [cferrero@camyo.com](mailto:cferrero@camyo.com)  
Domicilio: Bogotá, Colombia.

**IDENTIFICACIÓN**

C.C. ☒ NIT ☐  
C.E. ☐ Otro ☐  
Cual \_\_\_\_\_  
Número 438.019 T.P 31.929

4

**INVENTOR (ES)  
(72)**

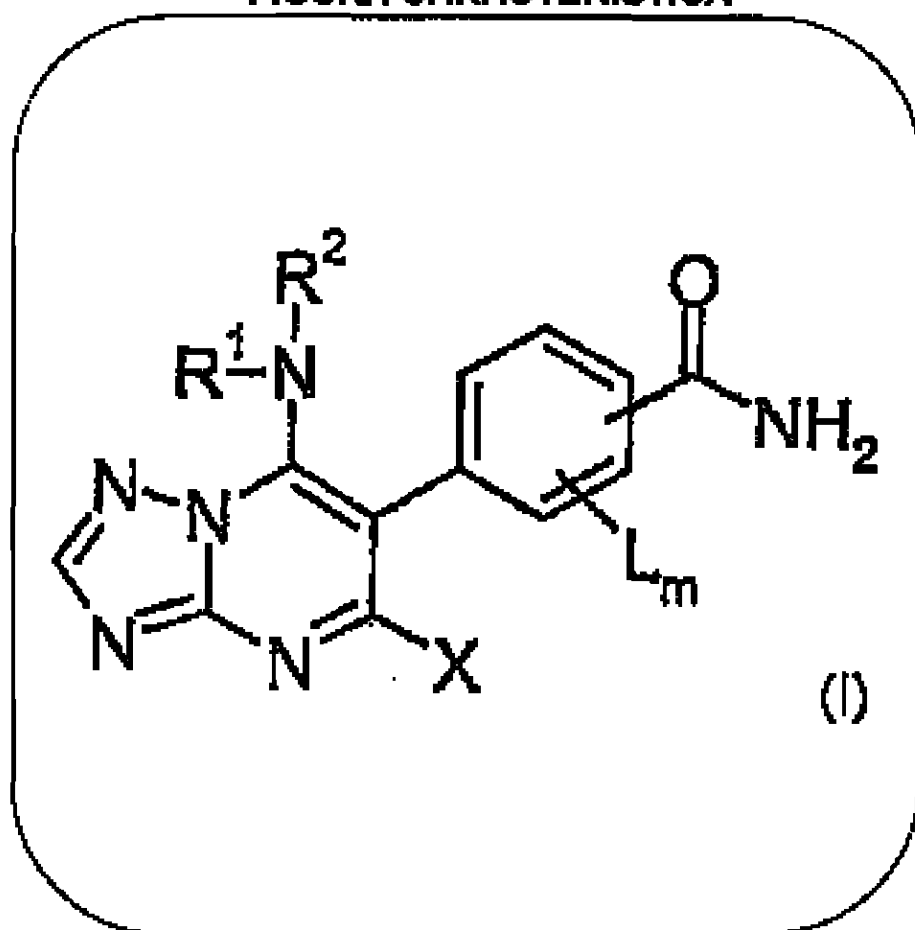
- |                                                                                                                         |                                                                                                               |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1. <b>Jordi TORMO I BLASCO</b><br>Carl-Benz-Strasse.10-3,<br>69514 Laudenbach,<br>República Federal de Alemania         | 2. <b>Carsten BLETNER</b><br>Richard-Wagner-Strasse.48,<br>68165 Mannheim,<br>República Federal de Alemania   |
| 3. <b>Bernd MÜLLER</b><br>Stockingerstrasse. 7,<br>67227 Frankenthal,<br>República Federal de Alemania                  | 4. <b>Markus GEWEHR</b><br>Goethestrasse. 21,<br>56268 Kastellaun,<br>República Federal de Alemania           |
| 5. <b>Wassilios GRAMMENOS</b><br>Alexander-Fleming-Strasse. 13,<br>67071 Ludwigshafen,<br>República Federal de Alemania | 6. <b>Thomas GROTE</b><br>Im Höhnhausen 18,<br>67157 Wachenheim,<br>República Federal de Alemania             |
| 7. <b>Joachim RHEINHEIMER</b><br>Merziger Strasse.24,<br>67063 Ludwigshafen,<br>República Federal de Alemania           | 8. <b>Peter SCHÄFER</b><br>Römerstrasse. 1,<br>67308 Ottersheim<br>República Federal de Alemania              |
| 9. <b>Frank SCHIEWECK</b><br>Lindenweg 4,<br>67258 Hessheim,<br>República Federal de Alemania                           | 10. <b>Anja SCHWÖGLER</b><br>Heinrich-Lanz-Strasse. 3,<br>68165 Mannheim<br>República Federal de Alemania     |
| 11. <b>Oliver WAGNER</b><br>Im Meisental 50,<br>67433 Neustadt<br>República federal de Alemania                         | 12. <b>Maria SCHERER</b><br>Hermann-Jürgens-Strasse.30,<br>76829 Godramstein<br>República Federal de Alemania |
| 13. <b>Siegfried STRATHMANN</b><br>Donnersbergstrasse. 9,<br>67117 Limburgerhof<br>República Federal de Alemania        | 14. <b>Ulrich SCHÖFL</b><br>Erlenstrasse 8,<br>68782 Brühl,<br>República Federal de Alemania                  |

|                                                                                            |                                                                                                                                                                                                               |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 15. Reinhard STIERL<br>Jahnstrasse 8,<br>Freinsheim 67251<br>República Federal de Alemania |                                                                                                                                                                                                               |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| 5                                                                                          | <b>PCT (86)</b><br>Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/014393</u> Fecha: <u>17 de diciembre de 2004</u><br>Publicación Internacional No. <u>WO 2005/081502 A1</u> Fecha: <u>7 de julio de 2005</u>      |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| 6                                                                                          | <b>TÍTULO (54)</b><br><u>6-(AMINOCARBONIL-FENIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS. PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y SU USO PARA EL COMBATE DE HONGOS DAÑINOS, ASI COMO AGENTES QUE LAS CONTIENEN.</u>                  |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| 7                                                                                          | <b>Clasificación Internacional (51)</b> <u>C07D 487/04</u>                                                                                                                                                    |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| 8                                                                                          | <b>Prioridad</b><br>SI <input checked="" type="checkbox"/> NO <input type="checkbox"/>                                                                                                                        | <b>(33) País de Origen</b><br><u>DE</u><br><u>DE</u><br><u>DE</u> | <b>(32) Fecha</b><br><u>19 de diciembre de 2003</u><br><u>23 de enero de 2004</u><br><u>19 de abril de 2004</u> | <b>(31) Número de Solicitud</b><br><u>10380382.1</u><br><u>102004003767.1</u><br><u>102004019458.4</u> |
| 9                                                                                          | <b>Comprobante de pago No.:</b> <u>08-44.160</u> <b>Fecha:</b> <u>12 de junio de 2008</u>                                                                                                                     |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| 10                                                                                         | <b>Anexos:</b>                                                                                                                                                                                                |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00.                                                                                                                             |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.                                                                                                                                                          |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.                                                                                                       |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Poderes, si fuere el caso.                                                                                                                                                                                    |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.                                                                                                                                              |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | Declaraciones.                                                                                                                                                                                                |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)                                                                                                                        |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)                                                                                                     |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.                                                                                                                                                            |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.                                                                                                                                                       |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | De ser el caso, copia del contrato de acceso.                                                                                                                                                                 |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.                                                                         |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.                                                                                                                                               |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Arte final 12x12                                                                                                                                                                                              |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input type="checkbox"/>                                                                   | 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. |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |
| <input checked="" type="checkbox"/>                                                        | Otras: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS                                                                                                                                                                          |                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                        |

3

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA:

*Emilio Ferrero*

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

**DOCUMENTOS ANEXOS**

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2005/081502 A1**

Descripción:

Páginas 49 en el idioma original

Páginas 73 en español

Reivindicaciones: Número (s) 11

Figuras: Número (s)

2. ☒ **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. 31829; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, al primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o al tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Consulado de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, autorizándose por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso. Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizamos a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ojoran o no jurisdicción, especialmente ante los 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 fábricas, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y señas; 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, transcribir, desistir, cancelar, recibir, renunciar y ratificar los actos hechos por agentes oficiales.

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

en **D-6700 Ludwigshafen**

**BASF Aktiengesellschaft**

*[Firma]*  
 tpa. Walzel

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

## VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (des) .....  
**BASF Aktiengesellschaft**

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

verfassen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31829; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beschaffen, 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 zeitweiliger oder definitiver Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dasselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fällen 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 Ausland; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Reglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen meines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, hinfallen, einer oder anderen, ordnungsgemäß werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund als auszuüben mit Anhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise. Ausserdem, und unter denselben Regeln, wir verfahren den gesamten Rechtsanwalts die Vollmacht, und um den Schutz meines (unserer) industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck ich (wir) die gesamten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, strittigen Verwaltungs, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erhaltung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Schutz-, Defensiv- und Servicezeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen und -zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Namen und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragsklagen; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmaßnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder strittigen Verwaltungssachen, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat erfüllen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und außergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter besorgen.

Unterzeichnet heute am **17. März 1989** in **D-6700 Ludwigshafen**

*[Firma]*  
 tpa. Richters

**09 JUN 2006**

U.R.Nr. 1407/89

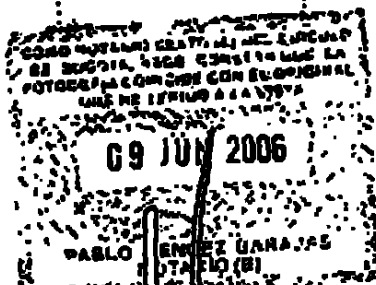
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorst.  
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für  
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein  
handelnden Herren:

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

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

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

Ludwigshafen am Rhein, den 17. März 1989



*[Handwritten signature]*

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarsessors  
Thomas Walter

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-  
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

*[Handwritten signature]*  
(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM

*[Handwritten note:]*  
17.3.89  
25.3.89  
32.3.89  
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  
Foder 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. Gunthar  
WELZEL y el Dr. Peter RICHTERS-----  
quien(es) en sus carácter(es) de apoderados-----  
----- y cuya(s) firma(s) fué  
(fueron) autenticada(n) ante el Notario Thomas Walter----  
----- es(son) su(s) representante(s) legal(es) en este país.

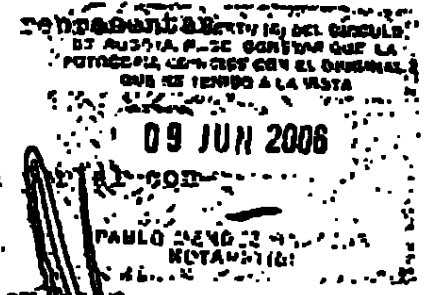
El Cónsul General no asume responsabilidad  
tenido del documento.

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

Frankfurt a. M. 06 APR 1989

**PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE**

Am 103.60 des Land E. S. H. H.



W-0077

*Martha Niño de Guzmán*  
Martha Niño de Guzmán  
Cónsul General de Colombia

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, según lo necesario autenticar la firma de éste.



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES  
LEGALIZACIONES  
Cuba, No 85464  
FEB 18 2006  
*Martha Nino*  
CUBA, REPUBLICA DE  
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES  
LEGALIZACIONES

*Amable*  
CUBA, REPUBLICA DE  
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES  
LEGALIZACIONES

CUBA, REPUBLICA DE  
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES  
LEGALIZACIONES  
09 JUN 2006  
PABLO MEDEZ/MAJAS  
NOTARIO

881051599954

| DECLARACION Y PAGO DEL<br>IMPUESTO D<br>TIMBR<br>NACION                                                                              |  |                                                                            |  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|----------------------------------------------------------------------------|--|
| 16 013 01 000045 1                                                                                                                   |  | 16 013 01 000045 1                                                         |  |
| 1 Administración de Impuestos de:                                                                                                    |  | Código                                                                     |  |
| BOGOTA                                                                                                                               |  | 03                                                                         |  |
| 2 Documento de identificación (porcentaje)                                                                                           |  | 3 Teléfono                                                                 |  |
| CC. A T. <input type="checkbox"/> C <input type="checkbox"/> NT. <input checked="" type="checkbox"/> A <input type="checkbox"/> Ya   |  | 2120100                                                                    |  |
| 850041367                                                                                                                            |  | 4 Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres). |  |
| D.V. <input type="checkbox"/> 3                                                                                                      |  | CAVELIER ABOGADOS                                                          |  |
| 5 CC. A T. <input type="checkbox"/> C <input checked="" type="checkbox"/> NT. <input type="checkbox"/> A <input type="checkbox"/> No |  | 6 Apellidos y Nombres o Razón Social de los partes (máximo 60 caracteres). |  |
| 19'301.629                                                                                                                           |  | FORERO ROCHA JADME                                                         |  |
| 7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la tabla 4)                                                                     |  | 8 Municipio                                                                |  |
| Cra. 4a. No. 72-35                                                                                                                   |  | BOGOTA                                                                     |  |
| 9 Departamento                                                                                                                       |  | 10 Código de verificación                                                  |  |
| CUNDINAMARCA                                                                                                                         |  | 1                                                                          |  |
| 11 Relación entre el sujeto de declaración, impuesto sobre, base, valor y concepto de la transacción                                 |  |                                                                            |  |
| <p>TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1999</p> <p>PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER</p> <p>COLO 0361-52-218-8</p>  |  |                                                                            |  |

|       |                      |
|-------|----------------------|
| FIRMA | Responsable del pago |
|       | Nombre               |
|       | CC. No.              |

|                              |     |
|------------------------------|-----|
| 1 VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR | 750 |
| 2 Descuento                  | 0   |
| 3 Impuesto a pagar           | 750 |
| 4 TOTAL A PAGAR              | 750 |

9

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 presenta.-

(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1949, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

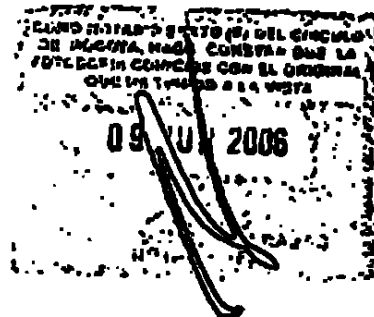
Protocolo notarial No. 1407/89

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 , químico, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein.

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona.

1



Certifico, por haber tenido a la vista el registro de comercio HR N 3000, del Juzgado de Ludwigshafen, que los doctores Witzel y Richter, 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

(nella redonda:)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

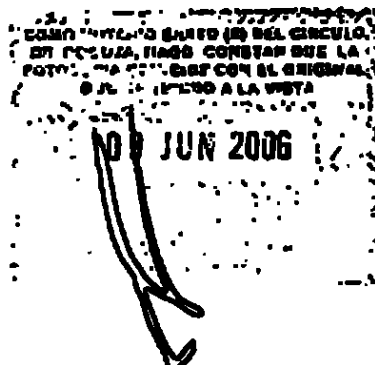
Notario de Ludwigshafen

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 este acto oficial.

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



El Presidente del Tribunal Regional

Firma: firma ilegible (sello redondo)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional  
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derechos 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

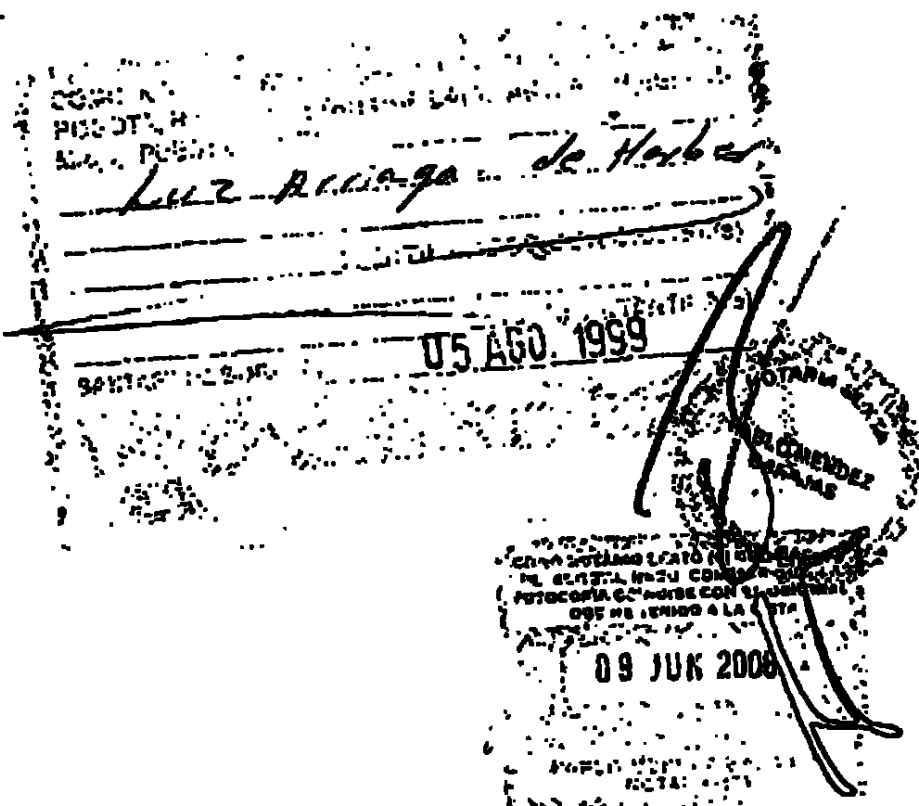
ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en  
los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Mogeta, 16 de abril de 1989

LUZ ANRIAGA DE HERZEN

TRADUCCION E INTERPRETE OFICIAL

Registro No. 559 Profesional



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES  
LEGALIZACIONES  
No. 89043  
Luz DE Herrera  
Sup. de la ...  
Comandante ...  
En ...

FOUR NOTICIA ...  
DE SOCIEDAD ...  
FOTOCOPIA ...  
QUE NO TIENEN A LA VISTA  
09 JUN 200  
PABLO ALONSO ...  
NOTAR ...

# CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No. 72-25  
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

COMANDO ELECTRONICO MUNICIPAL CAVE

TELEFONO 157. 111 7178186

CAMEL 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, 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 64 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos fallan en este momento.

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.724 de Bogotá

Acepto:

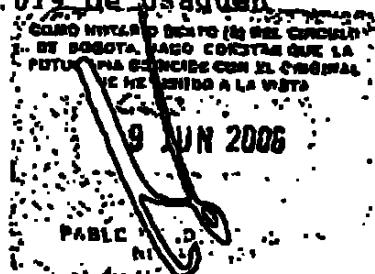
EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-780-2

CAVELIER ABOGADOS NIT. 860.041.367-3



**DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA  
CON PRESENTACION PERSONAL**

(Art. 1ro. del Decreto 2222 de 1990)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circuito de Santafé de Bogotá, compareció, el Doctor EMILIO F. RAMÍREZ

quien exhibió su cédula de ciudadanía número 4128791  
expedida en BOGOTÁ y la tarjeta profesional  
número 26.924 del Ministerio de Justicia, con  
el presente documento dirigido a: R.D. HUARIN (Aparecido)  
y declaró que la firma que aparece en él 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 2222 de 1990)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circuito de Santafé de Bogotá, compareció, el Doctor RAMIRO GARCIA

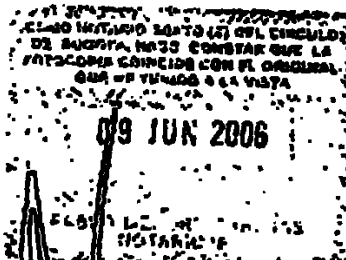
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 2022224  
expedida en BOGOTÁ y la tarjeta profesional  
número 937 del Ministerio de Justicia, con  
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación  
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

**01 OCT. 1993**

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



H

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

1798  
Colombia

0000055195

**CESSION**

**ASSIGNMENT**

Yo, (anexos), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

*Jordi Torno i Blasen*  
*Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach*  
*Germany*  
*Citizen of Spain*  
*Carsten Blettner*  
*Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Bernd Müller*  
*Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Markus Gwehr*  
*Goethestr. 21, 36288 Kastellaun*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Wassilios Grammenos*  
*Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen*  
*Germany*  
*Citizen of Greece*  
*Thomas Grotz*  
*Im Hühnhausen 18, 67157 Wachenheim*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Joachim Rheinheimer*  
*Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Peter Schäfer*  
*Römerstr.1, 67308 Ottersheim*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Frank Schieweck*  
*Lindenweg 4, 67258 Hefheim*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Anja Schwöglar*  
*Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*

domiciliado(s) en

© CAVELIER ABOGADOS  
STP001483-143

CJ Assignment Form 01 11/98

Oliver Wagner  
Im Meisental 30, 67433 Neustadt  
Germany  
Citizen of Germany  
Maria Scherer  
Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Giodramstein  
Germany  
Citizen of Germany  
Siegfried Struthmann  
Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof  
Germany  
Citizen of Germany  
Ulrich Schöff  
Erlenstr. 8, 68782 Brühl  
Germany  
Citizen of Germany  
Reinhard Silerl  
Jahnstr. 8, 67231 Freinsheim  
Germany  
Citizen of Germany

declam(amos) bajo juramento ser único(s) y verdad(es) de la invención: 6-(aminocarbonylphenyl)-triazolopyrimidines,   
 ~~Procedimientos para su preparación y su uso para el control de Hongos dañinos, así como agentes que los~~

5 declamo(amos) así mismo que cedu(amos) y ~~conten~~ transferu(emos), sin limitación, a favor de la sociedad

*Basf Aktiengesellschaft*

constituida y existente de conformidad con las leyes de

*Alemania*

domiciliada en

*67056 Ludwigshafen, Alemania*

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

state(s) under oath to be sole and true inventor(s) of the invention: 6-(Aminocarbonylphenyl) triazolopyrimidines, their preparation, their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising them

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

*BASF Aktiengesellschaft*

a corporation constituted and existing in conformity with the laws of

*Germany*

domiciled in

*67056 Ludwigshafen, Germany*

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

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

  
Jordi Tormo i Blasco

  
Carsten Blettner

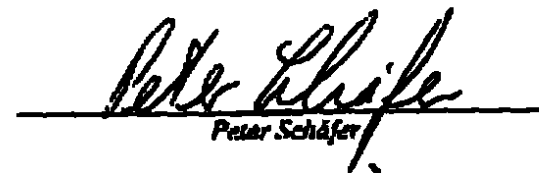
  
Bernd Müller

  
Markus Geyer

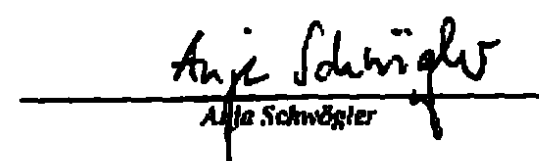
  
Wastlios Giroumenos

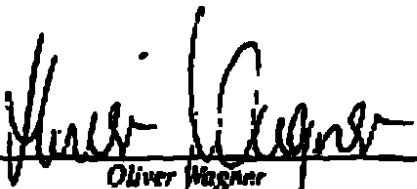
  
Thomas Grote

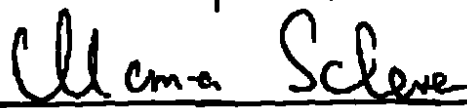
  
Joachim Rheinheimer

  
Peter Schäfer

  
Frank Schieweck

  
Anja Schwögl

  
Oliver Wagner

  
Maria Schner

  
Siegfried Strathmann

  
Ulrich Schöfl

  
Reinhard Sierl

**Urk.R.Nr. 1625/2004**

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

1. Mr. Jordi Torme i Blasco, residing at Carl-Benz-Straße 10-3, 69514 Laudendach, , Germany, personally known to me,
2. Mr. Carsten Blettner, residing at Richard-Wagner-Straße 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
3. Mr. Bernd Müller, residing at Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
4. Mr. Markus Gewehr, residing at Goethestraße 21, 56298 Kastellaun, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios Grammenos, residing at Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
6. Mr. Thomas Grote, residing at Im Hohnhausen 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
7. Mr. Joachim Rheinheimer, residing at Merziger Straße 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
8. Mr. Peter Schäfer, residing at Römerstraße 1, 67308 Ottersheim, Germany, personally known to me,
9. M. Frank Schieweck, residing at Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Germany, personally known to me,
10. Mrs. Anja Schwöglar, residing at Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
11. Mr. Oliver Wagner, residing at Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Germany, personally known to me,
12. Mrs. Maria Scherer, residing at Hermann-Jürgens-Straße 30, 76829 Godramstein, Germany, personally known to me,

13. Mr. Siegfried Strathmann, residing at Donners-  
bergstraße 9, 67117 Limburgerhof, Germany, perso-  
nally known to me,
14. Mr. Ulrich Schöfl, residing at Erlenstr. 8,  
68782 Brühl, Germany, personally known to me,
15. Mr. Reinhard Stierl, residing at Jahnstraße 8,  
67251 Freinsheim, Germany, personally known to  
me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 19<sup>th</sup> day of July, 2004



A handwritten signature, likely of the Notary Public, is written in black ink.

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 les                    días del mes de                    de 200

On this 19<sup>th</sup> day of July                    2004

ante mí, Notario Público de  
compareció(eron) personalmente

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

Jordi Torno i Blasco, Carsten Blettner,  
Berné Müller, Markus Gwehr,  
Wassilios Grammenos, Thomas Grote,  
Jochim Rheinheimer, Peter Schäfer,  
Frank Schieweck, Anja Schwöglar,  
Oliver Wagner, Maria Scherer,  
Siegfried Strathmann, Ulrich Schöfl  
and Reinhard Stierl

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

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



Notario Público

Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAPELLER ASSOCIATES  
WFFNERS-43

CA Notary Public Form 01 (2-94)

## A P O S T I L L E

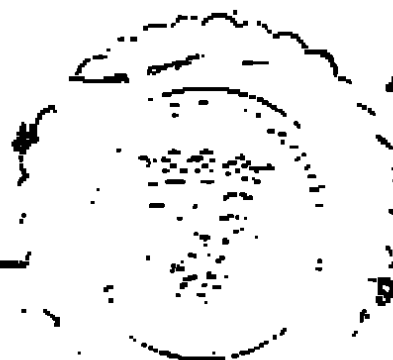
(Convention de La Haye du 5 octobre 1951)

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 Kb - 922-935/04

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift



*Werner Tholey*  
 (Werner Tholey)

Kostenvermerk:  
 Gebühr 12,-- €

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 17/05.06 preparada por María Elvira Marleto, traductora oficial aprobada por el Ministerio de Justicia mediante resolución 2879 de 1999 y reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores.

---

Colombia

0000055195

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones otorgados en inglés en un documento de fecha 19 de julio de 2004 por el cual la invención "6-(aminocarbonilfenil)-triazolopirimidinas, procedimiento para su preparación y su uso para el control de hongos dañinos así como agentes que las contengan" es cedida por sus inventores a la sociedad **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**:

**Urk.R.Nr. 1525/2004**

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

1. Sr. Jordi Tormo i Blasco, residente en Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania, conocido personalmente por mí
2. Sr. Carsten Blettner, residente en Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Alemania, conocido personalmente por mí
3. Sr. Bernd Müller, residente en Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal, Alemania, conocido personalmente por mí
4. Sr. Markus Gewehr, residente en Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun, Alemania, conocido personalmente por mí
5. Sr. Wassilios Grammenos, residente en Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, conocido personalmente por mí
6. Sr. Thomas Grote, residente en Im Hühnhaus 18, 67157 Wachenheim, Alemania, conocido personalmente por mí

7. Sr. Joachim Rheinheimer, residente en Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, conocido personalmente por mí
8. Sr. Peter Schäfer, residente en Römerstr. 1. 67308 Ottersheim, Alemania, conocido personalmente por mí
9. Sr. Frank Schieweck, residente en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania, conocido personalmente por mí
10. Sra. Anja Schwöglar, residente en Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania, conocida personalmente por mí
11. Sr. Oliver Wagner, residente en Im Melsental 50, 67433 Neustadt, Alemania, conocido personalmente por mí.
12. Sra. Maria Scherer, residente en Hermann-Jürgens-Strasse 30, 76829 Godramstein, Alemania, conocida personalmente por mí
13. Sr. Sigfried Strathmann, residente en Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, conocido personalmente por mí
14. Sr. Ulrich Schöffl, residente en Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania, conocido personalmente por mí
15. Sr. Reinhard Stierl, residente en Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania, conocido personalmente por mí

Son genuinas y válidas.

Ludwigshafen / Rhine, 19 de julio de 2004

[Firma ilegible], Notario

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

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (INDIVIDUO) otorgada en inglés y español, de fecha 19 de julio de 2004, en relación con las firmas de Jordi Tormo i Blasco, Carsten Blettner, Bernd Müller, Markus Gewehr, Wassillos Grammenos, Thomas Grote.

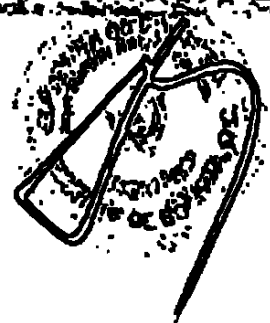
*Maria Elvira Martelo*  
TRADUCCION No. 11/06.06  
MARIA ELVIRA MARTELO  
Traductora e Interprete Oficial  
Inglés - Español - Inglés  
Reg. No. 2879 Min. Justicia

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO  
2006 JUN 17 A 11:37  
JEFE DE CALIFICACIONES  
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES  
EXTERIORES

02037  
Haga Harib  
CON FIRMAS APARECER EN EL  
DOCUMENTO DE SEÑALADA  
A 05 F 10-005100000000

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE  
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE  
Yacey Pluma  
Matteu  
CONCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR  
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA  
SANTA FE DE BOGOTA.  
12 JUN 2006



23

Joachim Rheinheimer, Peter Schäfer, Frank Schieweck, Anja Schwöglar, Oliver  
Wagner, Maria Scherer, Sigfried Strathmann, Ulrich Schöfl, Reinhard Stierl.

Firma ilegible, Notario Público.

Sello de Ludwig Draxel-Fischer

---

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

---

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

COLO 00361-841-108-0

WPCL-0361-ID 4613

JUN 09/06

*Maria S. Martelo*  
TRADUCCION No: 17/06.06  
MARIA ELVIRA MARTELO  
Traductora e Interprete Oficial  
Inglés - Español - Inglés  
Res. No. 2879 Min. Justicia

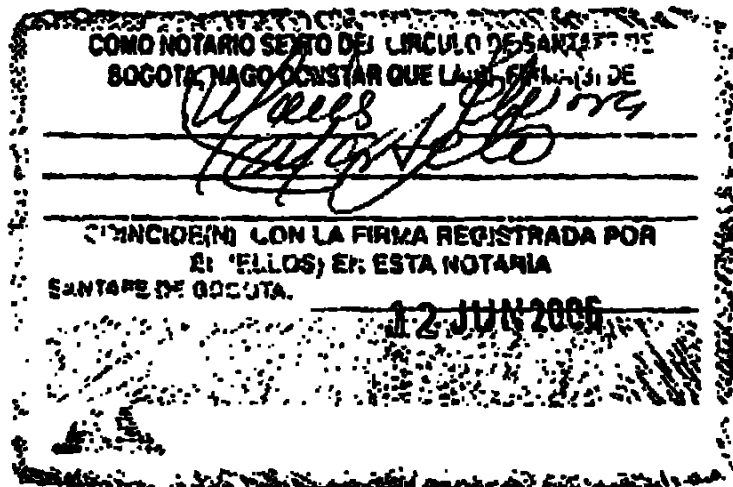
NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 JUN 12 A 11:32

11113  
JEFE DE LEGALIZACIONES  
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES  
EXTERIORES

026331  
Hona Harte  
CITA FIRMA APARECE EN EL  
DOCUMENTO DE EMPLERA  
LAS FIRMAS DE LOS



**TRADUCCION OFICIAL No. 11427**

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

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

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

**LUZ ARRIAGA DE HERBER**  
TRADUCCION OFICIAL  
*[Firma]*  
Resolución No. 599 del 6 de marzo 1978

- 11- Oliver Wagner  
Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania  
Ciudadano de Alemania
- 12- Maria Scherer  
domiciliada en Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein, Alemania  
Ciudadana de Alemania
- 13- Siegfried Strathmann,  
domiciliado en Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof, Alemania,  
Ciudadano de Alemania,
- 14- Ulrich Schöfl  
domiciliado en Erlenstr. 8, 66782 Brühl, Alemania  
Ciudadano de Alemania
- 15- Reinhard Stierl  
domiciliado en Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania  
Ciudadano de Alemania

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

**6-(aminocarbonilfenil)-triazolapirimidinas, procedimientos para su preparación y su uso para el combate de hongos dañinos así como agentes que los contienen**

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

Sigue: Autenticación notarial en inglés de las quince firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio de 2004, bajo el No. 1825/2004. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros

**LIZ ARRIAGA DE HERBER**  
TRADUJÓ Y AUTENTICÓ OFICIAL  
*[Firma]*  
Resolución No. 824 N. 14-311014

**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 09 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 €

Sigue: Autenticación notarial en inglés de las quince firmas antecedentes (individuo) por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio de 2004. Fdo.: firma ilegible, sello notarial No. 1 en tinta.

**LUZ ARRIAGA DE HARBER**  
**TRADUCCION E INTERPRETE JURADO**  
*[Firma]*  
Resolución No. 589 Mr. Jul 23

MINISTERIO DE RELACIONES  
EXTERIORES

1126300  
Amaya  
LA FIRMA APARECE EN EL  
DOCUMENTO DESENTENADA  
1387000051000000

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

20 JUN 12 A H: 37  
1118  
RECEBE LEGALIZACIONES  
SECRETARIA DE JUSTICIA D.E.

**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 09 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, 08 de junio de 2006**

**C. 3514**

**LUZ ARRIAGA DE HERRERA**  
**TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL**  
*Luz Arriaga de Herrera*  
**Registrada No. 6194 en Bogotá**

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 JUN 12 A 11:33

JEFE DE REGALAZAJES  
MINISTERIO DE BOGOTÁ D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES  
EXTERIORES

026390  
Amaga  
CUALQUIERA APARECE EN EL  
DOCUMENTO DE EMISIÓN  
LAS FIRMAS DE LOS

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE  
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LAS FIRMAS DE

*[Firma]*  
*[Firma]*

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

12 JUN 2006

*[Firma]*



(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
7. Juli 2005 (07.07.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2005/061502 A1

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 487/04,  
A01N 43/90 B (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/014393

(22) Internationales Anmeldedatum:  
17. Dezember 2004 (17.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10360392.1 19. Dezember 2003 (19.12.2003) DE  
103004003767.1 23. Januar 2004 (23.01.2004) DE  
102004019456.4 19. April 2004 (19.04.2004) DE

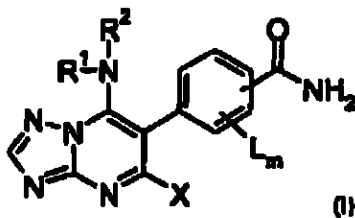
(71) Anmelder (für alle Benennungssituationen mit Ausnahme  
von US): BASF Aktiengesellschaft (DE/DE); 67056  
Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und  
(73) Erfinder/Anmelder (nur für US): TURMO I BLASCO,  
Jordi (ES/DE); Carl-Hertz-Str.10-3, 69514 Laudenbach  
(DE). BLETINKER, Carsten (DE/DE); Richard-Wag-  
ner-Str.48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd  
(DE/DE); Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE).  
GRWEHR, Markus (DE/DE); Goethestr. 21, 56288  
Kastellan (DE). GRAZIANINOS, Wladimir (GR/DE);  
Alexander-Platz-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).  
GROTH, Thomas (DE/DE); Im Höhenhausen 18, 67157  
Wachenheim (DE). HILFENHEIMER, Joachim (DE/DE);  
Merziger Str.34, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER,  
Peter (DE/DE); Rönnefeldt, 67308 Oßersheim (DE).  
SCHIEWICK, Frank (DE/DE); Lindenweg 4, 67358  
Heidelberg (DE). SCHWÖGLER, Anja (DE/DE); Hei-  
nrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). WAGNER,  
Oliver (DE/DE); Im Molental 50, 67433 Neustadt (DE).  
SCHEER, Maria (DE/DE); Hermann-Jürgens-Str.30,  
76829 Goddardsheim (DE). STRATTMANN, Siegfried  
(DE/DE); Dannerburgstr.9, 67117 Limburgerhof (DE).  
SCHÖFL, Ulrich (DE/DE); Erlener. 8, 68782 Brühl

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 6-(AMINOCARBONYL-PHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF,  
USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI, AND SUBSTANCES CONTAINING THE SAME

(54) Bezeichnung: 6-(AMINOCARBONYL-PHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG  
UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHÄDLICHEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) Abstract: Disclosed are triazolopyrimidines of formula (I), wherein the substituents have the following meaning: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> represent hydrogen, alkyl, alkyl halide, cycloalkyl, heterocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, heterocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, or phenyl, naphthyl, or a five-membered to six-membered saturated, partially unsaturated, or aromatic heterocycle containing one to four heteroatoms from the group comprising O, N, and S. R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> can also form a five-membered or six-membered heterocyclyl or heteroaryl along with the nitrogen atom to which the same are bonded, said heterocyclyl or heteroaryl being bonded via N, while optionally containing an additional heteroatom from the group comprising O, N, and S as a ring member and being optionally substituted according to the

description; L represents halogen, cyano, alkyl, alkyl halide, alkoxy, alkenyloxy, or alkoxy carbonyl; m represents 1, 2, 3, or 4, the groups L being optionally different if m is greater than 1; X represents halogen, cyano, alkyl, alkyl halide, alkoxy, or haloalkoxy. Also disclosed are methods and intermediate products for producing said compounds, substances containing the same, and the use thereof for controlling plant-pathogenic fungi.

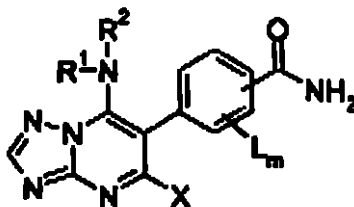
(57) Zusammenfassung: Triazolopyrimidine der Formel I in der die Seitenketten folgende Bedeutung haben: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Heterocycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Heterocycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und gemäß der Beschreibung substituiert sein; L Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy oder Alkoxy-carbonyl; m 1, 2, 3 oder 4, wobei die Gruppen L verschieden sein können wenn m größer als 1 ist; X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2005/061502 A1



6-(Aminocarbonylphenyl)triazolopyrimidines, process for their preparation and their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising these compounds

The present invention relates to substituted triazolopyrimidines of the formula I



5

In which the substituents are as defined below:

10  $R^1$ ,  $R^2$  independently of one another are hydrogen,  $C_1$ - $C_8$ -alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -haloalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -cycloalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -halocycloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -haloalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -halocycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -alkynyl,  $C_2$ - $C_8$ -haloalkynyl or phenyl, naphthyl or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15  $R^1$  and  $R^2$  together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen,  $C_1$ - $C_8$ -alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -haloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -haloalkenyl,  $C_1$ - $C_8$ -alkoxy,  $C_1$ - $C_8$ -haloalkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -alkenyloxy,  $C_3$ - $C_8$ -haloalkenyloxy, (exo)- $C_1$ - $C_8$ -alkylene and oxy- $C_1$ - $C_8$ -alkyleneoxy;

20

$R^1$  and/or  $R^2$  may carry one to four identical or different groups  $R^a$ :

25  $R^a$  is halogen, cyano, nitro, hydroxyl,  $C_1$ - $C_8$ -alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -haloalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -alkylcarbonyl,  $C_3$ - $C_8$ -cycloalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -alkoxy,  $C_1$ - $C_8$ -haloalkoxy,  $C_1$ - $C_8$ -alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_8$ -alkylthio,  $C_1$ - $C_8$ -alkylamino, di- $C_1$ - $C_8$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_8$ -alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -haloalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -cycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -alkenyloxy,  $C_3$ - $C_8$ -haloalkenyloxy,  $C_2$ - $C_8$ -alkynyl,  $C_2$ - $C_8$ -haloalkynyl,  $C_3$ - $C_8$ -alkynyloxy,  $C_3$ - $C_8$ -haloalkynyloxy,  $C_3$ - $C_8$ -cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_8$ -cycloalkenyloxy, oxy- $C_1$ - $C_8$ -alkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S.

30

35 where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups  $R^b$ :

**R<sup>b</sup>** is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals contain 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals contain 2 to 8 carbon atoms;

and/or one to three of the following radicals:

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclioxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to 10 ring members and the hetaryl radicals 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

**L** is halogen, cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyloxy or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxycarbonyl;

**m** is 1, 2, 3 or 4, where the groups **L** may be different if **m** is greater than 1;

**X** is halogen, cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalkoxy.

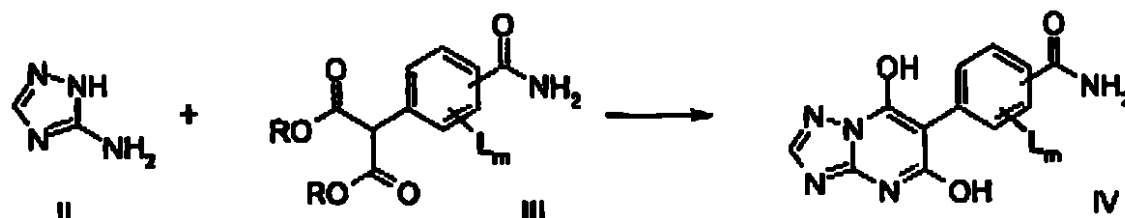
Moreover, the invention relates to processes and intermediates for preparing these compounds, to compositions comprising them and to their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

5-Chloro-6-phenyl-7-aminotriazolopyrimidines are known in a general manner from EP-A 71 792 and EP-A 550 113. 6-Phenyltriazolopyrimidines whose phenyl group may carry an alkylamide group in the para-position are proposed in a general manner in WO 03/080615. These compounds are known to be suitable for controlling harmful fungi.

The compounds according to the invention differ from those described in WO 03/080615 by the carboxamide group as substituent of the 6-phenyl ring.

However, the action of the known compounds is in many cases unsatisfactory. On the basis thereof, it is an object of the present invention to provide compounds having improved activity and/or a broader activity spectrum.

- 5 We have found that this object is achieved by the compounds defined at the outset. Moreover, we have found processes and intermediates for their preparation, compositions comprising them and methods for controlling harmful fungi using the compounds I.
- 10 The compounds according to the invention can be obtained by different routes. Advantageously, they are prepared by reacting 5-aminotriazol of the formula II with appropriately substituted phenylmalonates of the formula III in which R is alkyl, preferably C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, in particular methyl or ethyl.



- 15 This reaction is usually carried out at temperatures of from 80°C to 250°C, preferably from 120°C to 180°C, without solvent or in an inert organic solvent in the presence of a base [cf. EP-A 770 615] or in the presence of acetic acid under the conditions known from Adv. Het. Chem. 57 (1993), 81 ff.
- 20 Suitable solvents are aliphatic hydrocarbons, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, halogenated hydrocarbons, ethers, nitriles, ketones, alcohols, and also N-methylpyrrolidone, dimethyl sulfoxide, dimethylformamide and dimethylacetamide. With particular preference, the reaction is carried out in the absence of a solvent or in chlorobenzene, xylene, dimethyl sulfoxide or N-methylpyrrolidone. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned.

- Suitable bases are, in general, inorganic compounds, such as alkali metal and alkaline earth metal hydroxides, alkali metal and alkaline earth metal oxides, alkali metal and alkaline earth metal hydrides, alkali metal amides, alkali metal and alkaline earth metal carbonates, and also alkali metal bicarbonates, organometallic compounds, in particular alkali metal alkyls, alkyl magnesium halides and also alkali metal and alkaline earth metal alkoxides and dimethoxymagnesium, moreover organic bases, for example tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, trisopropylethylamine, tributylamine and N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, pyridine, substituted pyridines, such as collidine, lutidine and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic

amines. Particular preference is given to tertiary amines, such as trisopropylethylamine, tributylamine, N-methylmorpholine or N-methylpiperidine.

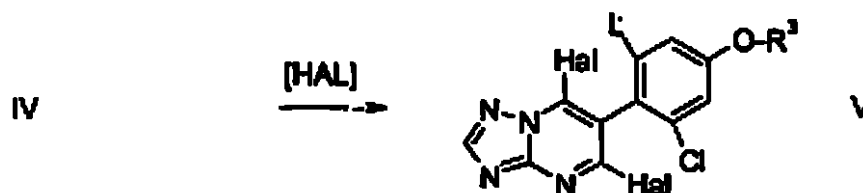
The bases are generally employed in catalytic amounts; however, they can also be employed in equimolar amounts, in excess or, if appropriate, as solvent.

The starting materials are generally reacted with one another in equimolar amounts. In terms of yield, it may be advantageous to use an excess of the base and the malonate III, based on the triazole.

10

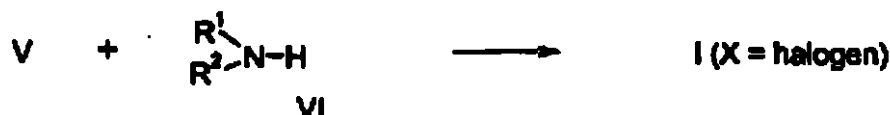
Phenylmalonates of the formula III are advantageously obtained from the reaction of appropriately substituted bromobenzenes with dialkyl malonates under Cu(I) catalysis [cf. Chemistry Letters (1981), 367-370; EP-A 10 02 788].

The dihydroxytriazolopyrimidines of the formula IV are, under the conditions known from WO-A 94/20501, converted into the dihalopyrimidines of the formula V in which Hal is a halogen atom, preferably a bromine or a chlorine atom, in particular a chlorine atom. The halogenating agent [HAL] used is advantageously a chlorinating agent or a brominating agent, such as phosphorus oxybromide or phosphorus oxychloride, if appropriate in the presence of a solvent.



This reaction is usually carried out at from 0°C to 150°C, preferably from 80°C to 125°C [cf. EP-A 770 615].

Dihalopyrimidines of the formula V are reacted further with amines of the formula VI



In which R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are as defined in formula I, to give compounds of the formula I in which X is halogen.

30

This reaction is advantageously carried out at from 0°C to 70°C, preferably from 10°C to 35°C, preferably in the presence of an inert solvent, such as an ether, for example dioxane, diethyl ether or, in particular, tetrahydrofuran, a halogenated hydrocarbon,

such as dichloromethane, or an aromatic hydrocarbon, such as, for example, toluene [cf. WO-A 98/46808].

- 5 The use of a base, such as a tertiary amine, for example triethylamine, or an inorganic base, such as potassium carbonate, is preferred; it is also possible for excess amine of the formula VI to serve as base.

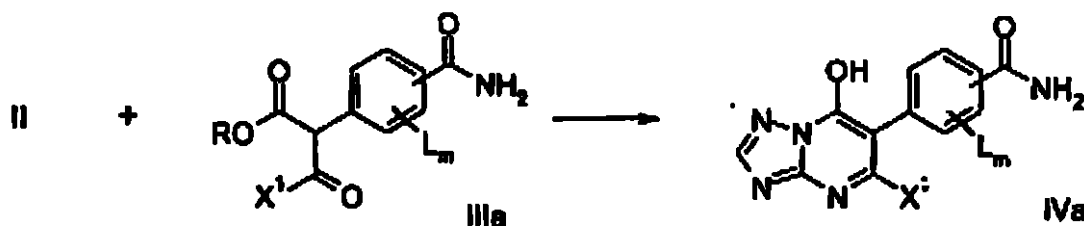
- 10 Compounds of the formula I in which X is cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalkoxy can be obtained in an advantageous manner by reacting compounds I in which X is halogen, preferably chlorine, with compounds M-X' (formula VII). Depending on the meaning of the group X' to be introduced, the compounds VII are inorganic cyanides, alkoxides or haloalkoxides. The reaction is advantageously carried out in the presence of an inert solvent. The cation M in formula VII is of little importance; for practical reasons, ammonium, tetraalkylammonium or alkali metal or alkaline earth metal salts are usually preferred.



The reaction temperature is usually from 0 to 120°C, preferably from 10 to 40°C [cf. J. Heterocycl. Chem. 12 (1975), 881-883].

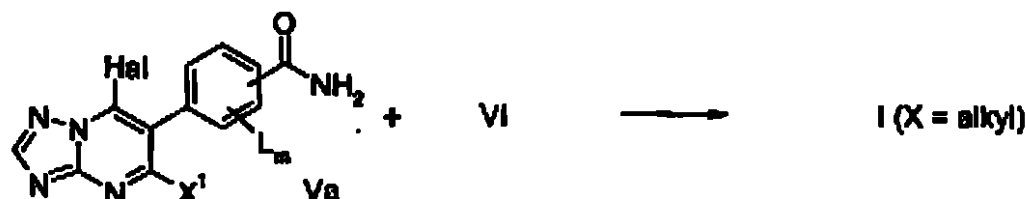
- 20 Suitable solvents include ethers, such as dioxane, diethyl ether and, preferably, tetrahydrofuran, halogenated hydrocarbons, such as dichloromethane, and aromatic hydrocarbons, such as toluene.

- 25 Compounds of the formula I, in which X is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl can be obtained in an advantageous manner by the following synthesis route:



- Starting with the keto esters IIIa, the 5-alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines IVa are obtained. In the formula IIIa and IVa, X<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl. By using the easily obtainable 2-phenylacetoacetates (IIIa where X<sup>1</sup> = CH<sub>3</sub>), the 5-methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines are obtained [cf. Chem. Pharm. Bull. 9 (1961), 801]. The starting materials IIIa are advantageously prepared under the conditions described in EP-A 10 02 788.

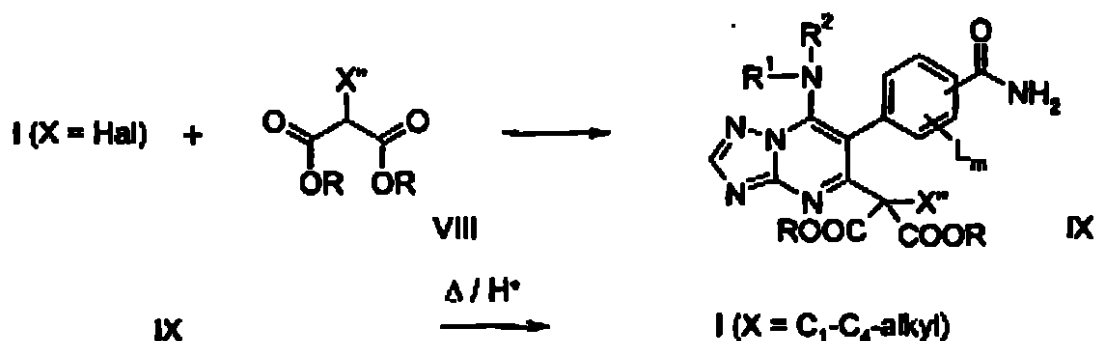
The resulting 5-alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines are reacted with halogenating agents [HAL] under the conditions described further above to give the 7-halotriazolopyrimidines of the formula Va. Preference is given to using chlorinating or brominating agents, such as phosphorus oxybromide, phosphorus oxychloride, thionyl chloride, thionyl bromide or sulfuryl chloride. The reaction can be carried out neat or in the presence of a solvent. Customary reaction temperatures are from 0 to 150°C or, preferably, from 80 to 125°C.



The reaction of Va with amines VI is carried out under the conditions described further above.

Alternatively, compounds of the formula I in which X is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl can also be prepared from compounds I in which X is halogen, in particular chlorine, and malonates of the formula VIII. In formula VIII, X'' is hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl and R is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl.

They are converted into compounds of the formula IX and decarboxylated to give compounds I [cf. US 5,994,360].



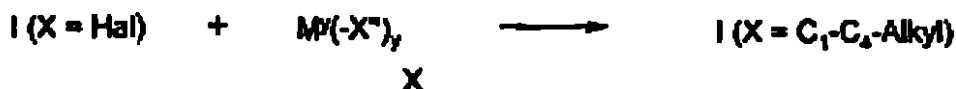
The malonates VIII are known from the literature [J. Am. Chem. Soc. 64 (1942), 2714; J. Org. Chem. 39 (1974), 2172; Helv. Chim. Acta, 61 (1978), 1565], or they can be prepared in accordance with the literature cited.

The subsequent hydrolysis of the ester IX is carried out under generally customary conditions; depending on the various structural elements, the alkaline or the acidic hydrolysis of the compounds IX may be advantageous. Under the conditions of the ester hydrolysis, there may already be complete or partial decarboxylation to I.

The decarboxylation is usually carried out at temperatures of from 20°C to 180°C, preferably from 50°C to 120°C, in an inert solvent, if appropriate in the presence of an acid.

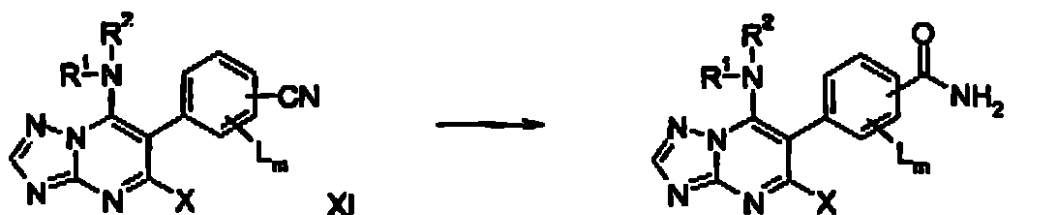
Suitable acids are hydrochloric acid, sulfuric acid, phosphoric acid, formic acid, acetic acid, p-toluenesulfonic acid. Suitable solvents are water, aliphatic hydrocarbons, such as pentane, hexane, cyclohexane and petroleum ether, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, halogenated hydrocarbons, such as methylene chloride, chloroform and chlorobenzene, ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, tert-butyl methyl ether, dioxane, anisole and tetrahydrofuran, nitriles, such as acetonitrile and propionitrile, ketones, such as acetone, methyl ethyl ketone, diethyl ketone and tert-butyl methyl ketone, alcohols, such as methanol, ethanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol and tert-butanol, and also dimethyl sulfoxide, dimethylformamide and dimethylacetamide; particularly preferably, the reaction is carried out in hydrochloric acid or acetic acid. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned.

Compounds of the formula I in which X is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl can also be obtained by coupling 5-halotriazolopyrimidines of the formula I in which X is halogen with organometallic reagents of the formula X. In one embodiment of this process, the reaction is carried out with transition metal catalysis, such as Ni or Pd catalysis.



In formula X, M is a metal ion of the valency y, such as, for example, B, Zn or Sn, and X<sup>n</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl. This reaction can be carried out, for example, analogously to the following methods: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1994), 1187, *ibid* 1 (1996), 2345; WO-A 99/41255; Aust. J. Chem. 43 (1990), 733; J. Org. Chem. 43 (1978), 358; J. Chem. Soc. Chem. Commun. (1979), 866; Tetrahedron Lett. 34 (1993), 8267; *ibid* 33 (1992), 413.

Alternatively, compounds of the formula I can also be prepared from substituted 6-cyanophenyltriazolopyrimidines of the formula XI.

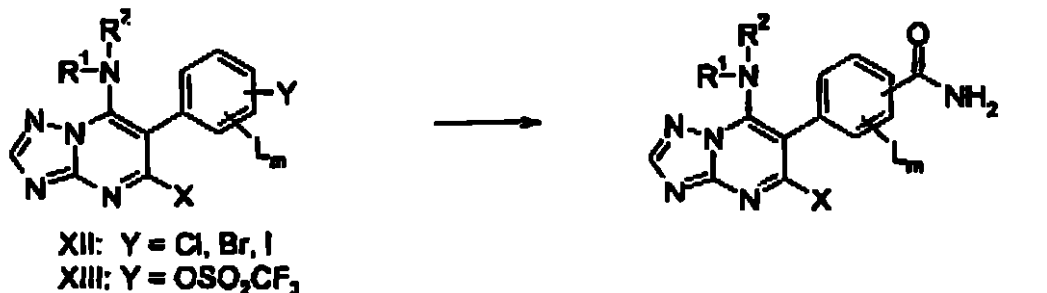


This reaction can be carried out in the presence of sulfuric acid at from 0 to 60°C, in particular from 20 to 25°C [cf. Synthetic Commun. (1999), 547 ff.], alternatively, the reaction can be carried out in the system polyethylene glycol/NaOH at from 0 to 60°C, in particular from 20 to 25°C, in the presence of a solvent or diluent [cf. Synthetic Commun. (2000), 1713 ff.], or using urea/hydrogen peroxide at from 0 to 60°C, in

particular from 20 to 25°C, in the presence of a solvent or diluent [cf. Org. Lett. (1999), 189 ff.].

Compounds of the formula XI are known from WO 03/080615 and/or can be prepared in accordance with the literature cited.

Moreover, the compounds of the formula I can be prepared by Pd-catalyzed aminocarbonylation [cf. Tetrahedron Lett. 39 (1988), 2835-2838; J. Org. Chem. 66, (2001), 4311 ff; WO 00/37428; DE 35 25 564; J. Org. Chem. 62 (1997), 8840-8853; JP 2000191612) of the corresponding halogen compounds XII [cf. EP-A 550113] or triflate XIII.



The reaction mixtures are worked up in a customary manner, for example by mixing with water, separating the phases and, if appropriate, chromatographic purification of the crude products. Some of the intermediates and end products are obtained in the form of colorless or slightly brownish viscous oils which are purified or freed from volatile components under reduced pressure and at moderately elevated temperature. If the intermediates and end products are obtained as solids, purification can also be carried out by recrystallization or digestion.

If individual compounds I cannot be obtained by the routes described above, they can be prepared by derivatization of other compounds I.

If the synthesis yields mixtures of isomers, a separation is generally not necessarily required since in some cases the individual isomers can be interconverted during work-up for use or during application (for example under the action of light, acids or bases). Such conversions may also take place after use, for example in the treatment of plants in the treated plant, or in the harmful fungus to be controlled.

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

halogen: fluorine, chlorine, bromine and iodine;

alkyl: saturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 1 to 4, 6 or 8 carbon atoms, for example  $C_1$ - $C_8$ -alkyl such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl;

10

haloalkyl: straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 2, 4 or 6 carbon atoms (as mentioned above), where in these groups some or all of the hydrogen atoms may be replaced by halogen atoms as mentioned above; in particular,  $C_1$ - $C_6$ -haloalkyl, such as chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, pentafluoroethyl or 1,1,1-trifluoroprop-2-yl;

15

20

alkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 4, 6 or 8 carbon atoms and one or two double bonds in any position, for example  $C_2$ - $C_8$ -alkenyl, such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methylethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-

35

butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl, 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;

haloalkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 8 carbon atoms and one or two double bonds in any position (as mentioned above), where in these groups some or all of the hydrogen atoms may be replaced by halogen atoms as mentioned above, in particular by fluorine, chlorine and bromine;

alkynyl: straight-chain or branched hydrocarbon groups having 2 to 4, 6 or 8 carbon atoms and one or two triple bonds in any position, for example  $C_2-C_8$ -alkynyl, such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butyne, 2-butyne, 3-butyne, 1-methyl-2-propynyl, 1-pentyne, 2-pentyne, 3-pentyne, 4-pentyne, 1-methyl-2-butyne, 1-methyl-3-butyne, 2-methyl-3-butyne, 3-methyl-1-butyne, 1,1-dimethyl-2-propynyl, 1-ethyl-2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-methyl-2-pentyne, 1-methyl-3-pentyne, 1-methyl-4-pentyne, 2-methyl-3-pentyne, 2-methyl-4-pentyne, 3-methyl-1-pentyne, 3-methyl-4-pentyne, 4-methyl-1-pentyne, 4-methyl-2-pentyne, 1,1-dimethyl-2-butyne, 1,1-dimethyl-3-butyne, 1,2-dimethyl-3-butyne, 2,2-dimethyl-3-butyne, 3,3-dimethyl-1-butyne, 1-ethyl-2-butyne, 1-ethyl-3-butyne, 2-ethyl-3-butyne and 1-ethyl-1-methyl-2-propynyl;

cycloalkyl: mono- or bicyclic saturated hydrocarbon groups having 3 to 6 or 8 carbon ring members, for example  $C_3-C_8$ -cycloalkyl such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl and cyclooctyl;

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

30 - 5- or 6-membered heterocyclyl which contains one to three nitrogen atoms and/or one oxygen or sulfur atom or one or two oxygen and/or sulfur atoms, for example 2-tetrahydrofuranyl, 3-tetrahydrofuranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-tetrahydrothienyl, 2-pyrrolidinyl, 3-pyrrolidinyl, 3-isoxazolidinyl, 4-isoxazolidinyl, 5-isoxazolidinyl, 3-isothiazolidinyl, 4-isothiazolidinyl, 5-isothiazolidinyl, 3-pyrazolidinyl, 4-pyrazolidinyl, 5-pyrazolidinyl, 2-oxazolidinyl, 4-oxazolidinyl, 5-oxazolidinyl, 2-thiazolidinyl, 4-

thiazolidinyl, 5-thiazolidinyl, 2-imidazolidinyl, 4-imidazolidinyl, 2-pyrrolin-2-yl, 2-pyrrolin-3-yl, 3-pyrrolin-2-yl, 3-pyrrolin-3-yl, 2-piperidinyl, 3-piperidinyl, 4-piperidinyl, 1,3-dioxan-5-yl, 2-tetrahydropyranyl, 4-tetrahydropyranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-hexahydropyridazinyl, 4-hexahydropyridazinyl, 2-hexahydropyrimidinyl, 4-hexahydropyrimidinyl, 5-hexahydropyrimidinyl and 2-piperazinyl;

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

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

alkylene: divalent unbranched chains of 3 to 5  $\text{CH}_2$  groups, for example  $\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$  and  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ;

oxyalkylene: divalent unbranched chains of 2 to 4  $\text{CH}_2$  groups, where one valency is attached to the skeleton via an oxygen atom, for example  $\text{OCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$  and  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ;

oxyalkyleneoxy: divalent unbranched chains of 1 to 3  $\text{CH}_2$  groups, where both valencies are attached to the skeleton via an oxygen atom, for example  $\text{OCH}_2\text{O}$ ,  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$  and  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ .

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

The particularly preferred embodiments of the intermediates with respect to the variables correspond to those of radicals L and  $\text{R}^3$  of formula I.

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

- 5 Preference is given to compounds of the formula I in which  $R^1$  is not hydrogen.

Particular preference is given to compounds I in which  $R^1$  is  $C_1$ - $C_6$ -alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -alkenyl or  $C_1$ - $C_6$ -haloalkyl.

- 10 Preference is given to compounds I in which  $R^1$  is a group A:



In which

- 15  $Z^1$  is hydrogen, fluorine or  $C_1$ - $C_6$ -fluoroalkyl,  
 $Z^2$  is hydrogen or fluorine, or  
 $Z^1$  and  $Z^2$  together form a double bond;  
 $q$  is 0 or 1; and  
 $R^2$  is hydrogen or methyl.

- 20 Moreover, preference is given to compounds I in which  $R^1$  is  $C_3$ - $C_6$ -cycloalkyl which may be substituted by  $C_1$ - $C_4$ -alkyl.

Particular preference is given to compounds I in which  $R^2$  is hydrogen.

- 25 Preference is likewise given to compounds I in which  $R^2$  is methyl or ethyl.

- If  $R^1$  and/or  $R^2$  comprise haloalkyl or haloalkenyl groups having a center of chirality, the (S) isomers are preferred for these groups. In the case of halogen-free alkyl or alkenyl groups having a center of chirality in  $R^1$  or  $R^2$ , preference is given to the (R) configured isomers.

- 30 Preference is furthermore given to compounds I in which  $R^1$  and  $R^2$  together with the nitrogen atom to which they are attached form a piperidiny, morpholiny or thiomorpholiny ring, in particular a piperidiny ring, which, if appropriate, is substituted by one to three groups halogen,  $C_1$ - $C_4$ -alkyl or  $C_1$ - $C_4$ -haloalkyl. Particularly preference is given to the compounds in which  $R^1$  and  $R^2$  together with the nitrogen atom to which they are attached form a 4-methylpiperidine ring.

The invention furthermore preferably provides compounds I in which R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together with the nitrogen atom to which they are attached form a pyrazole ring which, if appropriate, is substituted by one or two groups halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl, in particular by 3,5-dimethyl or 3,5-di(trifluoromethyl).

5

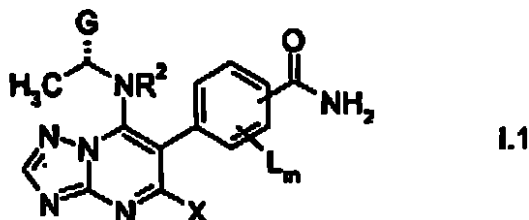
In addition, particular preference is also given to compounds of the formula I in which R<sup>1</sup> is CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, cyclopentyl or cyclohexyl; R<sup>2</sup> is hydrogen or methyl; or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together are -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- or -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.

10

Preference is given to compounds I in which X is halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, cyano or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, such as chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy, especially chlorine or methyl, in particular chlorine.

15

A preferred embodiment of the compounds of the formula I relates to compounds of the formula I.1:



in which

20 G is C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, in particular ethyl, n- and isopropyl, n-, sec-, tert-butyl, and C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxymethyl, in particular ethoxymethyl, or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, in particular cyclopentyl or cyclohexyl;

R<sup>2</sup> is hydrogen or methyl; and

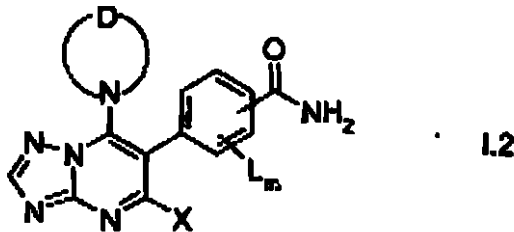
X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy.

25

A further preferred embodiment of the compounds of the formula I relates to compounds in which R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together with the nitrogen atom to which they are attached form a five- or six-membered heterocyclidyl or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and/or one or more substituents from the group consisting of halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylene and oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkylenoxy. These compounds correspond in particular to formula I.2.

30

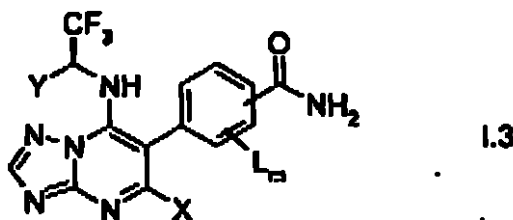
14



In which

- D together with the nitrogen atom forms a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -alkoxy and  $C_1-C_2$ -haloalkyl; and
- X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy.

- 10 A further preferred embodiment of the compounds of the formula I relates to compounds of the formula 1.3

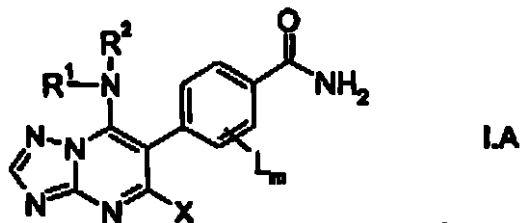


in which Y is hydrogen or  $C_1-C_4$ -alkyl, in particular methyl and ethyl, and X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy.

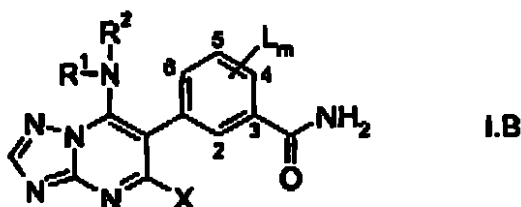
15

Particular preference is given to compounds of the formula I in which at least one substituent L is located ortho to the bond to the triazolo-pyrimidine skeleton, in particular a substituent selected from the group consisting of chlorine, fluorine and methyl.

- 20 A further preferred embodiment of the invention relates to compounds of the formula I in which the group  $C(O)NH_2$  is located in the 4-position; the compounds correspond to formula 1.A.

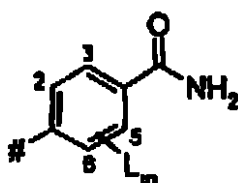


A further preferred embodiment of the invention relates to compounds of the formula I in which the group  $C(O)NH_2$  is located in the 3-position; the compounds correspond to formula I.B.

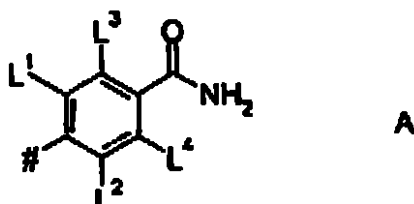


5

Particular preference is given to compounds of the formula I.A in which the phenyl group



10 corresponds to group A:



in which

$L^1$  is halogen, halomethyl or  $C_1-C_4$ -alkyl, in particular Cl, F or methyl;

$L^2, L^3, L^4$  are hydrogen or halogen,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_2$ -haloalkyl or  $C_1-C_4$ -alkoxy,

15 where # denotes the point of attachment to the triazolo-pyrimidine skeleton.

In particular with a view to their use, preference is given to the compounds I compiled in the tables below. Moreover, the groups mentioned for a substituent in the tables are per se, independently of the combination in which they are mentioned, a particularly preferred embodiment of the substituent in question.

20

#### Table 1

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

25

#### Table 2

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 3**

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

5

**Table 4**

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

10 **Table 5**

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 6**

15 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 7**

20 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 8**

25 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 9**

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro-6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

30 **Table 10**

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro-6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 11**

35 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro-6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 12**

40 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro-6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 13

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

5

## Table 14

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 10 Table 15

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 16

15 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 17

20 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 18

25 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 19

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 30 Table 20

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 21

35 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 22

40 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 23**

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**5 Table 24**

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 25**

**10** Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A.

**Table 26**

**15** Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 27**

**20** Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 28**

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**25 Table 29**

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,5-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 30**

**30** Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,5-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 31**

**35** Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,5-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 32**

**40** Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,5-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 33**

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,3,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**5 Table 34**

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,3,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 35**

**10** Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,3,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 36**

**15** Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,3,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 37**

**20** Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,5,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 38**

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,5,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**25 Table 39**

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,5,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 40**

**30** Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,5,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 41**

**35** Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 42**

**40** Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 43

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 44

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 45

10 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,3,6-trifluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 46

15 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,3,6-trifluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 47

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,3,6-trifluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

20

## Table 48

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,3,6-trifluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 49

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-methyl,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 50

30 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-methyl,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 51

35 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-methyl,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 52

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-methyl,5-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

40

## Table 53

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,5-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 54

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,5-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 55

10 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,5-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 56

15 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,5-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 57

20 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-fluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 58

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-fluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 59

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-fluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 60

30 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-fluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 61

35 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,3-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 62

40 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,3-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 63

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,3-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 64

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,3-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 65

10 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,5-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 66

15 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,5-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 67

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,5-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

20

## Table 68

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,5-dichloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 69

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,3,6-trichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 70

30 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,3,6-trichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 71

35 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,3,6-trichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 72

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,3,6-trichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

40

## Table 73

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-difluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 74

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-difluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 75

10 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-difluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 76

15 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-difluoro,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 77

20 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-methyl,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 78

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-methyl,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 79

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-methyl,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 80

30 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-methyl,5-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 81

35 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 82

40 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 83

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 84

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 85

10 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-fluoro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 86

15 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-fluoro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 87

20 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-fluoro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 88

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-fluoro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 89

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  2-chloro,5-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 90

30 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 91

35 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 92

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,5-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table

A

## Table 93

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,3-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 94

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,3-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 95

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,3-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 96

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,3-methyl,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 97

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 98

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 99

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 100

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 101

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 102

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 103

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 104

10 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 105

15 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,5-dimethyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 106

20 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,5-dimethyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 107

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,5-dimethyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 108

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,5-dimethyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 109

30 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 110

35 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 111

40 Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 112

Compounds of the formula IA in which X is methoxy, L<sub>m</sub> is 2-chloro,5-methoxy and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 113

Compounds of the formula IA in which X is chlorine, L<sub>m</sub> is 2-fluoro,5-methoxy and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 114

10 Compounds of the formula IA in which X is cyano, L<sub>m</sub> is 2-fluoro,5-methoxy and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 115

15 Compounds of the formula IA in which X is methyl, L<sub>m</sub> is 2-fluoro,5-methoxy and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 116

20 Compounds of the formula IA in which X is methoxy, L<sub>m</sub> is 2-fluoro,5-methoxy and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 117

25 Compounds of the formula IA in which X is chlorine, L<sub>m</sub> is 2-chloro,3-methoxy,6-fluoro and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 118

30 Compounds of the formula IA in which X is cyano, L<sub>m</sub> is 2-chloro,3-methoxy,6-fluoro and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 119

35 Compounds of the formula IA in which X is methyl, L<sub>m</sub> is 2-chloro,3-methoxy,6-fluoro and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 120

40 Compounds of the formula IA in which X is methoxy, L<sub>m</sub> is 2-chloro,3-methoxy,6-fluoro and the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 121

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

5

## Table 122

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

10

## Table 123

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

15

## Table 124

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,5-methoxy,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

20

## Table 125

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

25

## Table 126

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 127

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

30

## Table 128

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-dichloro,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

35

## Table 129

Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 130

Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

5 Table 131

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 132

10 Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-difluoro,3-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 133

15 Compounds of the formula I.A in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-methyl,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 134

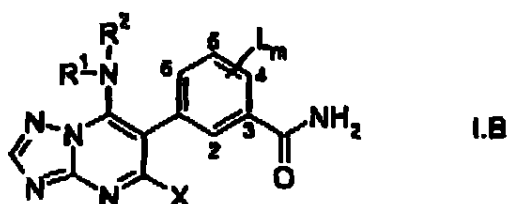
20 Compounds of the formula I.A in which X is cyano,  $L_m$  is 2-methyl,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 135

Compounds of the formula I.A in which X is methyl,  $L_m$  is 2-methyl,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

25 Table 136

Compounds of the formula I.A in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-methyl,5-methoxy and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A



30

Table 137

Compounds of the formula I.B in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 138

Compounds of the formula I.B in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 139

Compounds of the formula I.B in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 140

- 10 Compounds of the formula I.B in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 141

- 15 Compounds of the formula I.B in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 142

- 20 Compounds of the formula I.B in which X is cyano,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 143

Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 144

Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 145

- 30 Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-chloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 146

- 35 Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 2-chloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 147

- 40 Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 2-chloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 148**

Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-chloro,6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**5 Table 149**

Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 150**

**10** Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 151**

**15** Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 152**

**20** Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-dichloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 153**

Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**25 Table 154**

Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 155**

**30** Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 156**

**35** Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 2,6-difluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

**Table 157**

**40** Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 158

Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 159

Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 160

- 10 Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 161

- 15 Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 162

- 20 Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 163

Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 164

Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 165

- 30 Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 166

- 35 Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## Table 167

- 40 Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 168

Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 6-fluoro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 5 Table 169

Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 2-fluoro,6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 170

10 Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 2-fluoro,6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 171

15 Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 2-fluoro,6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 172

20 Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 2-fluoro,6-chloro and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 173

Compounds of the formula I.B, in which X is chlorine,  $L_m$  is 6-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

## 25 Table 174

Compounds of the formula I.B, in which X is cyano,  $L_m$  is 6-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 175

30 Compounds of the formula I.B, in which X is methyl,  $L_m$  is 6-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table 176

35 Compounds of the formula I.B, in which X is methoxy,  $L_m$  is 6-methyl and the combination of  $R^1$  and  $R^2$  corresponds for each compound to one row of Table A

Table A

| No. | $R^1$ | $R^2$ |
|-----|-------|-------|
| A-1 | H     | H     |

| No.  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>2</sup>                                                  |
|------|-----------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|
| A-2  | CH <sub>3</sub>                                                 | H                                                               |
| A-3  | CH <sub>3</sub>                                                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-4  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | H                                                               |
| A-5  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-6  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-7  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                 | H                                                               |
| A-8  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-9  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-10 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                                | H                                                               |
| A-11 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-12 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-13 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H                                                               |
| A-14 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-15 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-16 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-17 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H                                                               |
| A-18 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-19 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-20 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                                                               |
| A-21 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-22 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-23 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-24 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-25 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-26 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-27 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-28 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-29 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-30 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-31 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-32 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-33 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-34 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | H                                                               |
| A-35 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-36 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-37 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | H                                                               |
| A-38 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>3</sub>                                                 |

| No.  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>2</sup>                  |
|------|-----------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| A-39 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-40 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | H                               |
| A-41 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>3</sub>                 |
| A-42 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-43 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | H                               |
| A-44 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-45 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-46 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | H                               |
| A-47 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-48 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-49 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | H                               |
| A-50 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-51 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-52 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | H                               |
| A-53 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                 |
| A-54 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-55 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | H                               |
| A-56 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                 |
| A-57 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-58 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | H                               |
| A-59 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                 |
| A-60 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-61 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-62 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-63 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-64 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-65 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-66 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-67 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-68 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-69 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-70 | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | H                               |
| A-71 | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 |
| A-72 | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-73 | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | H                               |
| A-74 | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-75 | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |

| No.   | R <sup>1</sup>                                                | R <sup>2</sup>           |
|-------|---------------------------------------------------------------|--------------------------|
| A-76  | $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$                | H                        |
| A-77  | $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$                | $\text{CH}_3$            |
| A-78  | $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$                | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-79  | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$                            | H                        |
| A-80  | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$                            | $\text{CH}_3$            |
| A-81  | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$                            | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-82  | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$                 | H                        |
| A-83  | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$                 | $\text{CH}_3$            |
| A-84  | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$                 | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-85  | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$     | H                        |
| A-86  | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$     | $\text{CH}_3$            |
| A-87  | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$     | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-88  | $\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$                         | H                        |
| A-89  | $\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$                         | $\text{CH}_3$            |
| A-90  | $\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$                         | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-91  | cyclopentyl                                                   | H                        |
| A-92  | cyclopentyl                                                   | $\text{CH}_3$            |
| A-93  | cyclopentyl                                                   | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-94  | cyclohexyl                                                    | H                        |
| A-95  | cyclohexyl                                                    | $\text{CH}_3$            |
| A-96  | cyclohexyl                                                    | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-97  | $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$                            | H                        |
| A-98  | $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$                            | $\text{CH}_3$            |
| A-99  | $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$                            | $\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| A-100 | $-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$                    |                          |
| A-101 | $-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2-$        |                          |
| A-102 | $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{-CH}=\text{CHCH}_2-$ |                          |
| A-103 | $-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$      |                          |
| A-104 | $-(\text{CH}_2)_2\text{CHFCH}_2-$                             |                          |
| A-105 | $-(\text{CH}_2)_2\text{CHF}(\text{CH}_2)_2-$                  |                          |
| A-106 | $-\text{CH}_2\text{CHF}(\text{CH}_2)_3-$                      |                          |
| A-107 | $-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CF}_3)(\text{CH}_2)_2-$      |                          |
| A-108 | $-(\text{CH}_2)_2\text{O}(\text{CH}_2)_2-$                    |                          |
| A-109 | $-(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{CH}_2)_2-$                    |                          |
| A-110 | $-(\text{CH}_2)_6-$                                           |                          |
| A-111 | $-(\text{CH}_2)_4-$                                           |                          |
| A-112 | $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$                        |                          |

| No.   | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>                                                                                   |
|-------|----------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|
| A-113 |                | -CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                           |
| A-114 |                | -CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                           |
| A-115 |                | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                     |
| A-116 |                | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                          |
| A-117 |                | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                         |
| A-118 |                | -(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |
| A-119 |                | -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                          |
| A-120 |                | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                         |
| A-121 |                | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -                                                               |
| A-122 |                | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -                                          |
| A-123 |                | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -          |
| A-124 |                | -N=CH-CH=CH-                                                                                     |
| A-125 |                | -N=C(CH <sub>3</sub> )-CH=C(CH <sub>3</sub> )-                                                   |
| A-126 |                | -N=C(CF <sub>3</sub> )-CH=C(CF <sub>3</sub> )-                                                   |

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

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

They are especially suitable for controlling the following plant diseases:

- 15 • *Alternaria* species on fruit and vegetables,
- *Bipolaris* and *Drechslera* species on cereals, rice and lawns,
- *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
- *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamental plants and grapevines,
- 20 • *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
- *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
- *Mycosphaerella* species on cereals, bananas and peanuts,

- *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
- *Plasmopara viticola* on grapevines,
- *Podosphaera leucotricha* on apples,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* on wheat and barley,
- 5 • *Pseudoperonospora* species on hops and cucumbers,
- *Puccinia* species on cereals,
- *Pyricularia oryzae* on rice,
- *Rhizoctonia* species on cotton, rice and lawns,
- *Septoria tritici* and *Stagonospora nodorum* on wheat,
- 10 • *Uncinula necator* on grapevines,
- *Ustilago* species on cereals and sugar cane, and
- *Venturia* species (scab) on apples and pears.

15 The compounds I are also suitable for controlling harmful fungi, such as *Paecilomyces variotii*, in the protection of materials (e.g. wood, paper, paint dispersions, fibers or fabrics) and in the protection of stored products.

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

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

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

30 In seed treatment, amounts of active compound of 1 to 1000 g/100 kg of seed, preferably 1 to 200 g/100 kg, in particular 5 to 100 g/100 kg are generally required.

35 When used in the protection of materials or stored products, the amount of active compound applied depends on the kind of application area and on the desired effect. Amounts customarily applied in the protection of materials are, for example, 0.001 g to 2 kg, preferably 0.005 g to 1 kg, of active compound per cubic meter of treated material.

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

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

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

Suitable surfactants are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutyl-naphthalenesulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ethers, furthermore condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and formaldehyde, polyoxyethylene octylphenol ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether, tristearylphenyl polyglycol ether, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty alcohol/ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil, polyoxyethylene alkyl ethers, ethoxylated polyoxypropylene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

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

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

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

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

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

A Water-soluble concentrates (SL)

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

B Dispersible concentrates (DC)

20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in

cyclohexanone with addition of a dispersant, for example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion.

**C Emulsifiable concentrates (EC)**

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

**D Emulsions (EW, EO)**

- 10 40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5%). This mixture is introduced into water by means of an emulsifying machine (Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion.

15

**E Suspensions (SC, OD)**

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

20

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

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

25

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

- 30 75 parts by weight of a compound according to the invention are ground in a rotor-stator mill with addition of dispersants, wetters and silica gel. Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound.

**2. Products to be applied undiluted**

35

**H Dustable powders (DP)**

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

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

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

5

**J ULV solutions (UL)**

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

- 10 The active compounds can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom, for example in the form of directly sprayable solutions, powders, suspensions or dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dustable products, materials for spreading, or granules, by means of spraying, atomizing, dusting, spreading or pouring. The use forms depend entirely on the intended
- 15 purposes; the intention is to ensure in each case the finest possible distribution of the active compounds according to the invention.

- Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions,
- 20 pastes or oil dispersions, the substances, as such or dissolved in an oil or solvent, can be homogenized in water by means of a wetter, tackifier, dispersant or emulsifier. Alternatively, it is possible to prepare concentrates composed of active substance, wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

25

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

- 30 The active compounds may also be used successfully in the ultra-low-volume process (ULV), by which it is possible to apply formulations comprising over 95% by weight of active compound, or even to apply the active compound without additives.

Various types of oils, wetters, adjuvants, herbicides, fungicides, other pesticides, or bactericides may be added to the active compounds, if appropriate not until immediately prior to use (tank mix). These agents can be admixed with the agents according to the invention in a weight ratio of 1:10 to 10:1.

5

The compositions according to the invention can, in the use form as fungicides, also be present together with other active compounds, e.g. with herbicides, insecticides, growth regulators, fungicides or else with fertilizers. Mixing the compounds I or the compositions comprising them in the application form as fungicides with other  
10 fungicides results in many cases in an expansion of the fungicidal spectrum of activity being obtained.

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

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,
- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamine or lrdemorph,
- anilinoimidazoles, such as pyrimethanil, mefenpyrim or cyprodinyl,
- antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,
- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinilroconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil,  
25 penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizole or triticonazole,
- dicarboximides, such as iprodione, myclozolin, procymidone or vinclozolin,
- dithiocarbamates, such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metan, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram or zineb,  
30
- heterocyclic compounds, such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dilhianon, famoxedone, fenamidone, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenoxy, pyroquilon, quinoxifen, siltiofam,  
35 thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, trioxazole or triforine,

- copper fungicides, such as Bordeaux mixture, copper aceta , copper oxychloride or basic copper sulfate,
- nitrophenyl derivatives, such as binapacryl, dinocap, dinobuton or nitrophthal-isopropyl,
- 5 • phenylpyrroles, such as fenpiclonil or fludioxonil,
- sulfur,
- other fungicides, such as acibenzolar-S-methyl, benthialvalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, diclomezine, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin acetate, fenoxanil,
- 10 • ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenone, pencycuron, propamocarb, phthalide, tolclofos-methyl, quintozone or zoxamide,
- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxlm-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- 15 • sulfenic acid derivatives, such as captafol, captan, dichlofluanid, folpet or tolyfluanid,
- cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

## 20 Synthesis examples

The procedures described in the synthesis examples below were used to prepare further compounds by appropriate modification of the starting compounds. The resulting compounds are listed in the subsequent table with physical data.

25

Example 1 - Preparation of 5-chloro-6-(2,6-difluoro-4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidine

- HCl gas was passed through a solution of 1.5 mmol of 5-chloro-6-(2,6-difluoro-4-
- 30 cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidine [cf. WO 03/80615] in 20 ml of methanol until saturation was achieved. After 24 hours of stirring at about 20-25°C, the precipitate that had formed was filtered off and dissolved in dichloromethane. The solution was washed with water and dried, and the solvent was then removed. Chromatography on silica gel gave 140 mg of the title compound of
- 35 m.p. 197°C and 200 mg of the corresponding methyl ester of m.p. 176°C.

Example 2 - Preparation of 5-methyl-6-(2,6-difluoro-4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

Step 2a: 5-(dimethylmalon-2-yl)-6-(2,6-difluoro-4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

- 5 A solution of 1 g (2.7 mmol) of 5-chloro-6-(2,6-difluoro-4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine [cf. WO 03/80615] and 1 g of sodium dimethylmalonate (6.5 mmol) in 10 ml of acetonitrile was stirred at 70-80°C for 4 hours and at 20-25°C for 2.5 days. During this time, a yellow solid precipitate formed. The reaction mixture was filtered off through kieselguhr and the precipitate was stirred in a  
10 mixture of dil. hydrochloric acid and methylene chloride until it was decolorized. After phase separation, the aqueous phase was extracted with methylene chloride. Drying of the combined organic phases and distillative removal of the solvent gave 1 g of the title compound.
- 15 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8.4 (s, 1H); 7.4 (d, 2H); 4.65 (s, 1H); 3.7 (s, 6H); 3.55 (d, broad, 2H); 3.8 (l, broad, 2H); 1.65 (d, broad, 2H); 1.55 (m, 1H); 1.3 (m, 2H); 0.95 (d, 3H).

Step 2b: 5-methyl-6-(2,6-difluoro-4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine  
20

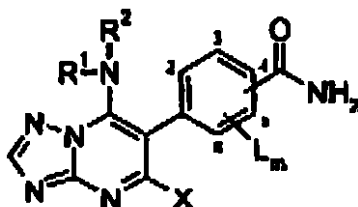
- A solution of 0.6 g (1.03 mmol) of 5-(dimethylmalon-2-yl)-6-(2,6-difluoro-4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine and 0.3 g (3.8 mmol) of 50% strength aqueous sodium hydroxide solution in 6 ml of  
25 methanol/water (5:1) was heated under reflux for 3 hours. After dilution with methyl t-butyl ether (MTBE) and dilute hydrochloric acid, the organic phase was separated off and the aqueous phase was extracted with MTBE. The combined organic phases were dried and freed from the solvent. The residue was purified by preparative MPLC on silica gel RP-18 using acetonitrile/water mixtures. The eluate gave, after removal of the  
30 solvent, 0.11 g of the title compound as a yellow resin.

- <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8.35 (s, 1H); 7.8 (d, 2H); 7.7 (s, broad, 1H); 6.75 (s, broad, 1H); 3.65 (d, 2H); 2.8 (l, 2H); 2.35 (s, 3H); 1.6 (d, 2H); 1.5 (m, 1H); 1.3 (m, 2H); 0.9 (d, 3H).

35

Table 1 - Compounds of the formula I

48



| No.  | R <sup>1</sup>                                                                           | R <sup>2</sup> | X               | L <sub>m</sub>                            | position<br>CONH <sub>2</sub> | phys. Data (m.p. [°C]:<br>1H-NMR δ [ppm])                                                                    |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|-----------------|-------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-1  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,6-F <sub>2</sub>                        | 4                             | 197                                                                                                          |
| I-2  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | CH <sub>3</sub> | 2,6-F <sub>2</sub>                        | 4                             | (Ex. 2b)                                                                                                     |
| I-3  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-F                                       | 4                             | 8.4 (s); 7.7 (m);<br>7.4 (t); 0.95 (d)                                                                       |
| I-4  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | 4                             | 130                                                                                                          |
| I-5  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 4                             | 162-164                                                                                                      |
| I-6  | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | 4                             | 240-241                                                                                                      |
| I-7  | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 4                             | 184                                                                                                          |
| I-8  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl,5-OCH <sub>3</sub>                   | 4                             | 190-191                                                                                                      |
| I-9  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,5-Cl <sub>2</sub>                       | 4                             | 198-199                                                                                                      |
| I-10 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-F                    | 4                             | 215-216                                                                                                      |
| I-11 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-F                    | 4                             | 214-215                                                                                                      |
| I-12 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl                   | 4                             | 223-225                                                                                                      |
| I-13 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>5-OCH <sub>3</sub> | 4                             | 2 atropisomers:<br>8.45; 8.4 (2s, 1H);<br>8.3; 8.35 (2s, 1H);<br>7.25; 7.1 (2s, 1H);<br>1.1; 1.0 (2d, 3H)    |
| I-14 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl                                      | 4                             | 247-249                                                                                                      |
| I-15 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-Cl                                      | 4                             | 2 atropisomers:<br>8.35 (s, 1H); 8.15 (d,<br>1H); 7.95 (m, 1H);<br>7.55; 7.5 (2d, 1H);<br>1.05; 0.9 (2d, 3H) |
| I-16 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl                   | 4                             | 2 atropisomers:<br>8.35 (s, 1H); 7.95; 7.9<br>(2s, 1H); 7.4; 7.35<br>(2s, 1H); 1.0 (d, 3H)                   |

47

| No.  | R <sup>1</sup>                                                                           | R <sup>2</sup> | X  | L <sub>m</sub>                            | position<br>CONH <sub>2</sub> | phys. Data (m.p. [°C],<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm])                                                              |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|----|-------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-17 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-Cl,5-CH <sub>3</sub>                    | 4                             | 205-208                                                                                                            |
| I-18 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-Cl,5-CH <sub>3</sub>                    | 4                             | > 250                                                                                                              |
| I-19 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub>                         | 5                             | > 250                                                                                                              |
| I-20 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-Cl                                      | 5                             | 8.3 (s); 8.0 (s);<br>7.9 (d); 7.5 (d); 0.9 (d)                                                                     |
| I-21 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-CH <sub>3</sub>                         | 5                             | 223                                                                                                                |
| I-22 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | 246-247                                                                                                            |
| I-23 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-Cl                                      | 5                             | 2 atropisomers: 8.4;<br>8.3 (2s, 1H); 8.2 (2s,<br>1H); 8.1; 8.03 (2d,<br>1H); 7.65 (d, 1H);<br>1.05; 0.95 (2d, 3H) |
| I-24 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | Polar (HPLC)<br>atropisomer: 8.35 (s,<br>1H); 8.1 (s, 1H); 7.0<br>(s, 1H); 0.95 (d, 3H)                            |
| I-25 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | Unpolar (HPLC)<br>atropisomer: 8.35 (s,<br>1H); 8.15 (s, 1H); 7.0<br>(s, 1H); 0.95 (d, 3H)                         |

#### Examples for the action against harmful fungi

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

The active compounds were prepared as a stock solution with 0.25% by weight of active compound in acetone or DMSO. 1% by weight of the emulsifier Uniperol® EL

- 10 (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkylphenols) was added to this solution, and the mixture was diluted with water to the desired concentration.

Use example 1 - Activity against net blotch of barley caused by *Pyrenophora teres*

- Leaves of pot-grown barley seedlings of the cultivar "Hanna" were sprayed to runoff point with an aqueous suspension having the concentration of active compound stated below. 24 hours after the spray coating had dried on, the test plants were inoculated with an aqueous spore suspension of *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *terus*, the causative agent of net blotch. The test plants were subsequently placed in a greenhouse at temperatures of between 20 and 24°C and at a relative atmospheric humidity of 95 to 100%. After 6 days, the extent of the development of the disease was determined visually in % of infection of the total leaf area.
- 10 In this test, the plants which had been treated with 63 ppm of the compounds I-1 or I-25 showed an infection of only about 3%, whereas the untreated plants were 90% infected.

15 Use example 2 - Activity against peronospora of vines caused by *Plasmopara viticola*

- Leaves of potted vines of the cultivar "Riesling" were sprayed to runoff point with an aqueous suspension having the concentration of active compounds stated below. The next day, the undersides of the leaves were inoculated with an aqueous zoospore suspension of *Plasmopara viticola*. The vines were then initially placed in a water-vapor-saturated chamber at 24°C for 48 hours and then in a greenhouse at temperatures of between 20 and 30°C for 5 days. After this time, the plants were again placed in a moist chamber for 16 hours to promote sporangiophore eruption. The extent of the development of the infection on the undersides of the leaves was then determined visually.
- 20
- 25 In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of the title compound from example 1 showed no infection, whereas the untreated plants were 90% infected.

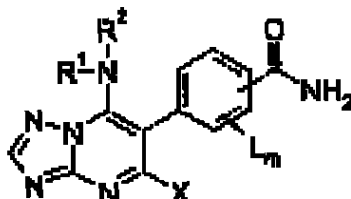
30 Use example 3 - Activity against gray mold on bell-pepper leaves caused by *Botrytis cinerea*, protective application

- Bell-pepper seedlings of the cultivar "Neusiedler Ideal Elite" were, after 2 to 3 leaves were well developed, sprayed to run-off point with an aqueous suspension having the concentration of active compounds stated below. The next day, the treated plants were inoculated with a spore suspension of *Botrytis cinerea* which contained  $1.7 \times 10^8$  spores/ml in a 2% aqueous biomold solution. Test plants were then placed in a dark climatized chamber at 22 to 24°C and high atmospheric humidity. After 5 days, the extent of the fungal infection on the leaves could be determined visually in %.
- 35

In this test, the plants which had been treated with 63 ppm of the compounds I-2, I-14, I-23, I-24 or I-25 showed an infection of not more than 30%, whereas the untreated plants were 75% infected.

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are as defined below:

$R^1, R^2$  independently of one another are hydrogen,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -haloalkyl,  $C_3-C_6$ -cycloalkyl,  $C_2-C_6$ -halocycloalkyl,  $C_2-C_6$ -alkenyl,  $C_2-C_6$ -haloalkenyl,

10  $C_2-C_6$ -cycloalkenyl,  $C_3-C_6$ -halocycloalkenyl,  $C_2-C_6$ -alkynyl,  $C_2-C_6$ -haloalkynyl or phenyl, naphthyl or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15  $R^1$  and  $R^2$  together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -haloalkyl,  $C_2-C_6$ -alkenyl,  $C_2-C_6$ -haloalkenyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy,  $C_1-C_6$ -haloalkoxy,  $C_2-C_6$ -alkenyloxy,  $C_2-C_6$ -haloalkenyloxy, (exo)- $C_1-C_6$ -alkylene and oxy- $C_1-C_6$ -alkyleneoxy;

20  $R^1$  and/or  $R^2$  may carry one to four identical or different groups  $R^a$ :

25  $R^a$  is halogen, cyano, nitro, hydroxyl,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -haloalkyl,  $C_1-C_6$ -alkylcarbonyl,  $C_2-C_6$ -cycloalkyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy,  $C_1-C_6$ -haloalkoxy,  $C_1-C_6$ -alkoxycarbonyl,  $C_1-C_6$ -alkylthio,  $C_1-C_6$ -alkylamino, di- $C_1-C_6$ -alkylamino,  $C_2-C_6$ -alkenyl,  $C_2-C_6$ -haloalkenyl,  $C_2-C_6$ -cycloalkenyl,  $C_2-C_6$ -alkenyloxy,  $C_2-C_6$ -haloalkenyloxy,  $C_2-C_6$ -alkynyl,  $C_2-C_6$ -haloalkynyl,  $C_2-C_6$ -alkynyloxy,  $C_2-C_6$ -haloalkynyloxy,  $C_2-C_6$ -cycloalkoxy,  $C_2-C_6$ -cycloalkenyloxy, oxy- $C_1-C_6$ -alkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

30 where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups  $R^b$ :

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

and/or one to three of the following radicals:

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclyloxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl- $C_1-C_6$ -alkoxy, aryl- $C_1-C_6$ -alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to 10 ring members and the hetaryl radicals 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

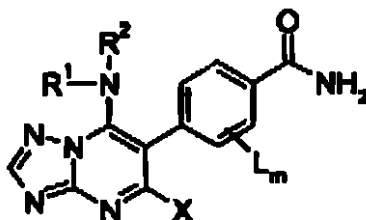
$L$  is halogen, cyano,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -haloalkyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy,  $C_3-C_6$ -alkenyloxy or  $C_1-C_4$ -alkoxycarbonyl;

$m$  is 1, 2, 3 or 4, where the groups  $L$  may be different if  $m$  is greater than 1;

$X$  is halogen, cyano,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -haloalkyl,  $C_1-C_4$ -alkoxy or  $C_1-C_2$ -haloalkoxy.

2. The compound of the formula I as claimed in claim 1, in which  $R^1$  is not hydrogen.

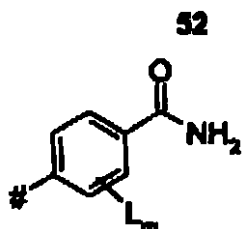
3. A compound of the formula I.A:



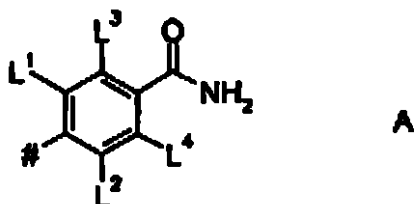
I.A

in which the variables are as defined in claim 1.

4. The compound of the formula I.A as claimed in claim 3 in which the phenyl group



corresponds to the group A:



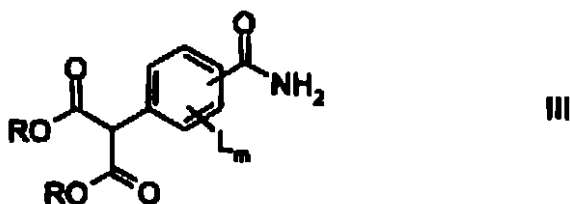
where

- 5      $L^1$      is halogen, halomethyl or  $C_1-C_4$ -alkyl;  
       $L^2, L^3, L^4$  are hydrogen or halogen,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_2$ -haloalkyl or  $C_1-C_4$ -alkoxy.

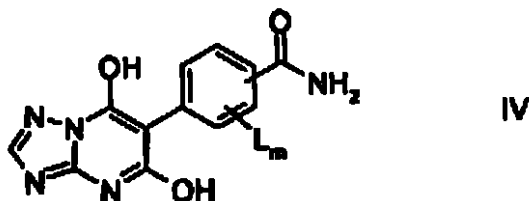
- 10     5. A process for preparing the compounds of the formula I as claimed in claim 1 in which X is halogen, cyano,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -alkoxy or  $C_1-C_2$ -haloalkoxy, by reaction of 5-amino-1,2,4-triazole of the formula II



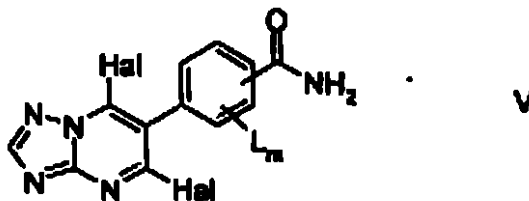
with phenylmalonates of the formula III,



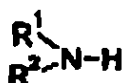
- 15     In which R is alkyl, with dihydroxytriazolopyrimidines of the formula IV,



halogenation to give the dihalo compounds of the formula V



and reaction of V with amines of the formula VI



VI

to give compounds of the formula I in which X is halogen, if desired, to prepare compounds I in which X is cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalkoxy, reaction of compounds I in which X is halogen with compounds of the formula VII,

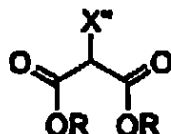
5



VII

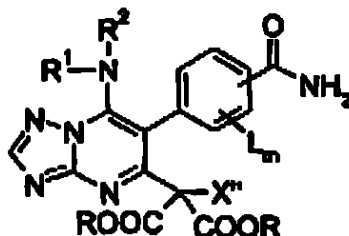
which, depending on the group X' to be introduced, are inorganic cyanides, alkoxides or haloalkoxides and in which M is an ammonium, tetraalkylammonium, alkali metal or alkaline earth metal cation, and, if desired, to prepare compounds of the formula I as claimed in claim 1 in which X is alkyl, by reaction of the

10



VIII

in which X'' is hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl and R is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, to give compounds of the formula IX

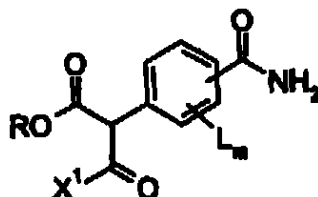


IX

15

and decarboxylation to give compounds I in which X is alkyl.

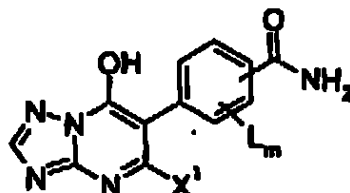
6. A process for preparing the compounds of the formula I as claimed in claim 1 in which X is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl, by reaction of 5-amino-7-hydroxy-8-phenyltriazolopyrimidines of the formula II as set forth in claim 5 with keto esters of the formula IIIa,



IIIa

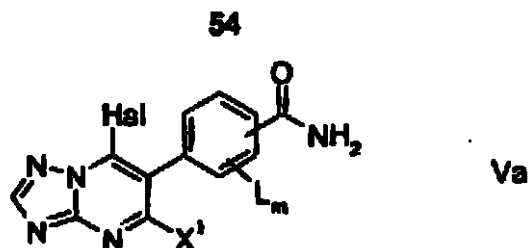
20

in which X<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl and R is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, to give 5-alkyl-7-hydroxy-8-phenyltriazolopyrimidines of the formula IVa



IVa

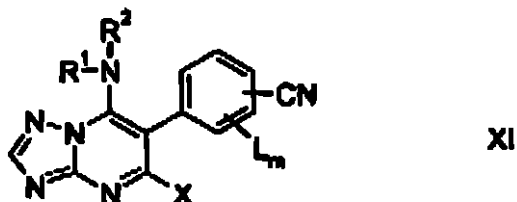
halogenation of IVa to give 7-halotriazolopyrimidines of the formula Va



and reaction of Va with amines of the formula VI as set forth in claim 5 to give compounds I in which X is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl.

5 7. A compound of the formula IV, IVa, V or Va as set forth in claims 5 and 6.

8. A process for preparing compounds of the formula I as claimed in claim 1 by reacting 6-cyanophenyltriazolopyrimidines of the formula XI



10 In the presence of sulfuric acid or in a polyethylene glycol/NaOH system or with urea/hydrogen peroxide.

9. A fungicidal composition, comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I as claimed in claim 1.

15

10. Seed, comprising 1 to 1000 g of a compound of the formula I as claimed in claim 1 per 100 kg.

20

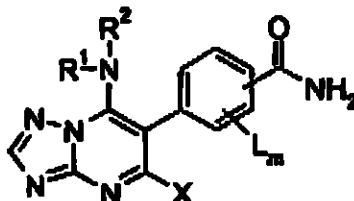
11. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I as claimed in claim 1.

6-(Aminocarbonylphenyl)triazolopyrimidines, their preparation and their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising these compounds

Abstract

5

Triazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are as defined below:

- 10 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> are hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl or phenyl, naphthyl or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- 15 R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and may be substituted as defined in the description;
- 20 L is halogen, cyano, alkyl, haloalkyl, alkoxy, alkenyloxy or alkoxycarbonyl;
- m is 1, 2, 3 or 4, where the groups L may be different if m is greater than 1;
- X is halogen, cyano, alkyl, haloalkyl, alkoxy or haloalkoxy;

25

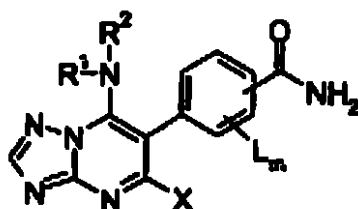
Processes and intermediates for preparing these compounds, compositions comprising them and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi

20500

**6-(AMINOCARBONIL-FENIL)-TRIAZOLOPRIMIDINAS,  
PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN Y SU USO PARA  
EL COMBATE DE HONGOS DAÑINOS, ASÍ COMO AGENTES  
QUE LAS CONTIENEN**

**Descripción**

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



en la que los sustituyentes tienen el siguiente significado:

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> de modo independiente entre sí, hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halogenalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, halogencicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, halogenalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halogencicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, halogenalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> o fenilo, naftilo o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> también pueden formar, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está unido a través de N y que puede contener uno a

tres heteroátomos más del grupo O, N y S como miembro del anillo y/o que puede llevar uno o varios sustituyentes del grupo halógeno, alquilo  $C_1-C_6$ , halogenalquilo  $C_1-C_6$ , alquenilo  $C_2-C_6$ , halogenalquenilo  $C_2-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , halogenalcoksi  $C_1-C_6$ , alqucniloxi  $C_3-C_6$ , halogenalqucniloxi  $C_3-C_6$ , (exo)-alquilenoxi  $C_1-C_6$  y oxi-alquilenoxi  $C_1-C_3$ ;

$R^1$  y/o  $R^2$  pueden llevar uno a cuatro grupos  $R^a$  iguales o diferentes:

$R^a$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, alquilo  $C_1-C_6$ , halogenalquilo  $C_1-C_6$ , alquilcarbonilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , halogenalcoksi  $C_1-C_6$ , alcóxicarbonilo  $C_1-C_6$ , alquiltio  $C_1-C_6$ , alquilamino  $C_1-C_6$ , di-alquilamino  $C_1-C_6$ , alqucnilo  $C_2-C_6$ , halogenalquenilo  $C_2-C_6$ , cicloalquenilo  $C_3-C_6$ , alqueniloxi  $C_2-C_6$ , halogenalqucniloxi  $C_3-C_6$ , alquinilo  $C_2-C_6$ , halogenalquinilo  $C_2-C_6$ , alquiniloxi  $C_3-C_6$ , halogenalquiniloxi  $C_3-C_6$ , cicloalcoksi  $C_3-C_6$ , cicloalqucniloxi  $C_3-C_6$ , oxi-alquilenoxi  $C_1-C_3$ , fenilo, naftilo, heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S, en donde estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos pueden estar, a su vez, parcial o completamente halogenados o pueden llevar uno a tres grupos  $R^b$ :

$R^b$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqucniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halogenalcoksi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino,

formilo, alquilarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxicarbonilo, alquilarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, en donde los grupos alquilo en estos radicales contienen 1 a 6 átomos de carbono y los grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales contienen 2 a 8 átomos de carbono;

y/o uno a tres de los siguientes radicales:

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterocicliloxi, en donde los sistemas cíclicos contienen 3 a 10 miembros de anillo; arilo, ariloxi, ariltio, aril-alcoxi  $C_1-C_6$ , aril-alquilo  $C_1-C_6$ , hetarilo, hetariloxi, hetariltio, en donde los radicales arilo contienen preferentemente 6 a 10 miembros de anillo, los radicales hetarilo contienen 5 o 6 miembros de anillo, en donde los sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos con grupos alquilo o haloalquilo.

- L es halógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_6$ , halogenalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , alqueniloxi  $C_3-C_6$  o alcoxicarbonilo  $C_1-C_4$ ;
- m 1, 2, 3 o 4, en donde los grupos L pueden ser diferentes cuando m es mayor que 1;
- X es halógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_4$ , halogenalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$  o halogenalcoxi  $C_1-C_2$ .

Además, la invención se refiere a procedimientos y productos

intermediarios para preparar estos compuestos, a los agentes que los contienen, así como a su uso para combatir hongos dañinos fitopatógenos.

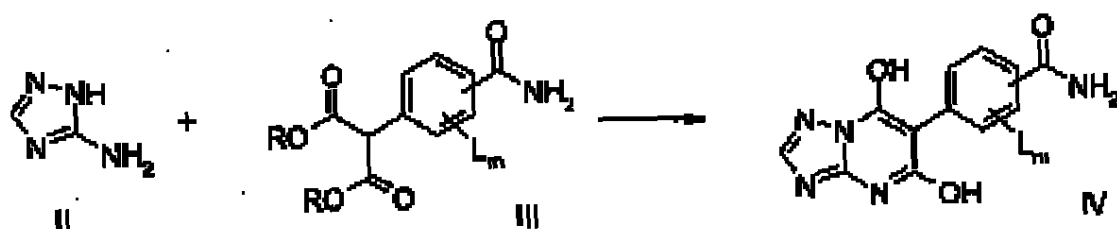
De los documentos EP-A 71 792, EP-A 550 113 se conocen en general las 5-cloro-6-fenil-7-amino-triazolopirimidinas. En el documento WO 03/080615 se proponen en general 6-fenil-triazolopirimidinas, cuyo grupo fenilo puede llevar un grupo alquilamida en posición para. Estos compuestos son conocidos para combatir hongos dañinos.

Los compuestos según la invención se distinguen de los compuestos descritos en el documento WO 03/080615 por el grupo amida de ácido carboxílico como sustituyente del anillo 6-fenilo.

Sin embargo, la acción de los compuestos conocidos no es satisfactoria en muchos casos. Partiendo de ello, es objeto de la presente invención poner a disposición compuestos con acción mejorada y/o mayor espectro de acción.

Conforme a ello, se hallaron los compuestos definidos al comienzo. Además, se hallaron procedimientos y productos intermediarios, agentes que los contienen, así como procedimientos para combatir hongos dañinos, utilizando los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos según la invención se pueden obtener por diversas vías. Ventajosamente, se obtienen por reacción de 5-aminotriazol de la fórmula II con fenilmalonatos de la fórmula III correspondientemente sustituidos, en la que R es alquilo, preferentemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, en especial metilo o etilo.



Esta reacción se lleva a cabo usualmente a temperaturas de 80° C a 250° C, con preferencia de 120° C a 180° C, sin solvente o en un solvente orgánico inerte en presencia de una base [compárese EP-A 770 615] o en presencia de ácido acético bajo las condiciones conocidas de Adv. Het. Chem. Vol. 57, pág. 81ff. (1993).

Solventes apropiados son hidrocarburos alifáticos, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, o-, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados, éteres, nitrilos, cetonas, alcoholes, así como N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, dimetilformamida y dimetilacetamida. Se prefiere en especial la reacción sin solventes o en clorobenceno, xileno, dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona. También se pueden usar mezclas de los solventes mencionados.

Como bases se tienen en cuenta, en general, compuestos inorgánicos tales como hidróxidos de metal alcalino y metal alcalinotérreo, óxidos de metal alcalino y metal alcalinotérreo, hidruros de metal alcalino y metal alcalinotérreo, amidas de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino y metal alcalinotérreo, así como hidrógeno-carbonatos de metal alcalino, compuestos organometálicos, en especial alquilos de metal alcalino, halogenuros de alquilmagnesio, así como alcoholatos de metal alcalino y metal alcalinotérreo y dimetoximagnesio, además bases orgánicas, por

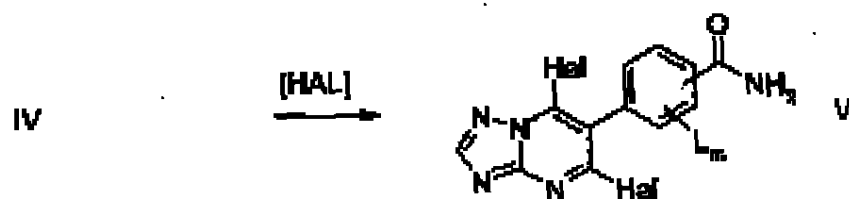
ejemplo aminas terciarias tales como trimetilamina, trietilamina, triisopropiletilamina, tributilamina y N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, piridina, piridinas sustituidas tales como colidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, así como aminas bicyclicas. Se prefieren especialmente las aminas terciarias tales como triisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina o N-metilpiperidina.

Las bases se utilizan en general en cantidades catalíticas, pero también se pueden usar de manera equimolar, en exceso o eventualmente como solvente.

Los eductos se hacen reaccionar entre sí en general en cantidades equimolares. Puede resultar ventajoso para el rendimiento utilizar la base y el malonato III en exceso respecto del triazol.

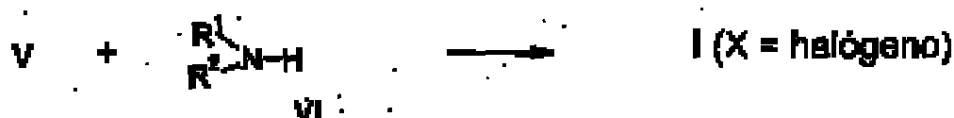
Los fenilmalonatos de la fórmula III se obtienen ventajosamente de la reacción de bromobencenos correspondientemente sustituidos con dialquilmalonatos bajo catálisis por Cu(I) [compárese Chemistry Letters, págs. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

Las dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV se convierten bajo las condiciones conocidas del documento WO-A 94/20501 en las dihalopirimidinas de la fórmula V, en la que Hal significa un átomo de halógeno, preferentemente un átomo de bromo o cloro, en especial un átomo de cloro. Como agente de halogenación [HAL] se utiliza ventajosamente un agente de cloración o un agente de bromación, tales como oxibromuro de fósforo u oxiclورو de fósforo, eventualmente en presencia de un solvente.



Esta reacción se lleva a cabo usualmente de 0° C a 150° C, preferentemente de 80° C a 125° C [compárese el documento EP-A 770 615].

Las dihalopirimidinas de la fórmula V se siguen convirtiendo con aminas de la fórmula VI,

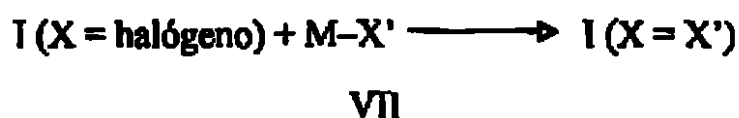


en la que R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> se definen tal como se definieron en la fórmula I, en compuestos de la fórmula I, en la que X es halógeno.

Esta reacción se lleva a cabo ventajosamente de 0° C a 70° C, preferentemente de 10° C a 35° C, con preferencia en presencia de un solvente inerte, tales como éteres, por ejemplo dioxano, éter dietílico o en especial tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano e hidrocarburos aromáticos, tales como, por ejemplo, tolueno [compárese el documento WO-A 98/46608].

Se prefiere el uso de una base, tales como aminas terciarias, por ejemplo trietilamina o bases inorgánicas, tales como carbonato de potasio; también sirve como base la amina en exceso de la fórmula VI.

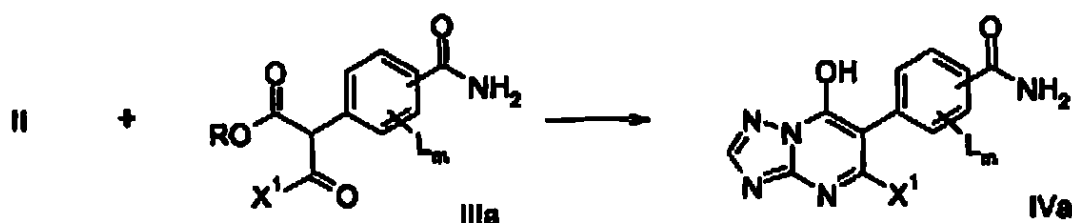
Ventajosamente, se pueden obtener compuestos de la fórmula I, en la que X significa ciano, alcoxi  $C_1-C_6$  o halogenalcóxi  $C_1-C_2$ , de la reacción de compuestos I, en la que X significa halógeno, preferentemente cloro, con compuestos  $M-X'$  (fórmula VII). Los compuestos VII representan, según el significado del grupo  $X'$  a introducir, un cianuro inorgánico, un alcóxido o un halogenalcóxido. La reacción se realiza ventajosamente en presencia de un solvente inerte. El catión M en la fórmula VII tiene un pobre significado; por razones de practicidad, se prefieren usualmente sales de amonio, tetraalquilamonio o de metales alcalinos o alcalinotérreos.



Usualmente, la temperatura de reacción varía entre 0 y 120° C, con preferencia entre 10 y 40° C [compárese J. Heterocycl. Chem., vol. 12, págs. 861-863 (1975)].

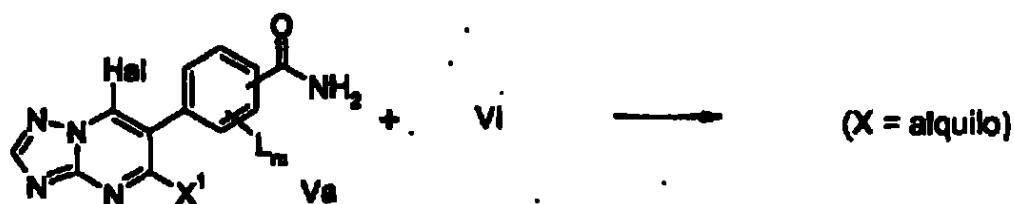
Solventes apropiados comprenden éteres, tales como dioxano, éter dietílico y, con preferencia, tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano e hidrocarburos aromáticos, tal como tolueno.

Se pueden obtener ventajosamente compuestos de la fórmula I, en la que X es alquilo  $C_1-C_4$  o halogenalquilo  $C_1-C_4$ , por medio de la siguiente vía de síntesis:



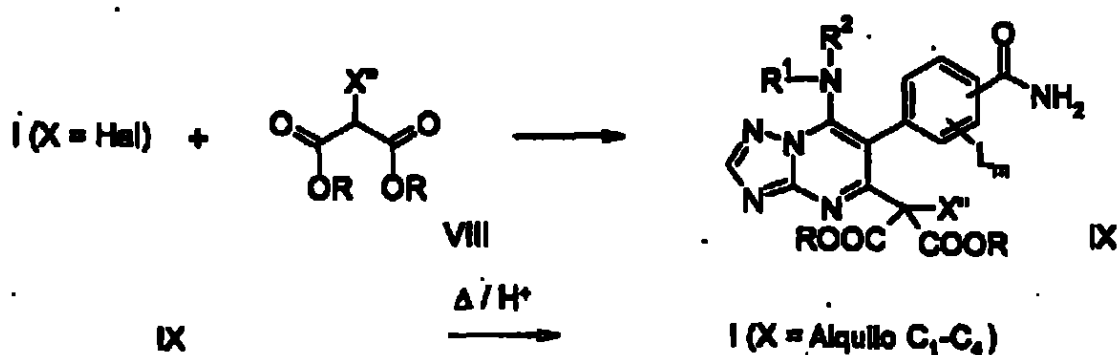
Partiendo de los cetoésteres IIIa se obtienen las 5-alkil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas IVa. En las fórmulas IIIa y IVa, X' es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. Usando ésteres 2-fenilacetacéticos de fácil acceso (IIIa con X' = CH<sub>3</sub>) se obtienen las 5-metil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas [compárese Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. La preparación de los compuestos de partida IIIa se realiza ventajosamente bajo las condiciones descritas en el documento EP-A 10 02 788.

Las 5-alkil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas obtenidas de esta manera se hacen reaccionar con agentes de halogenación [HAL] bajo las condiciones descritas más arriba en las 7-halogenotriazolopirimidinas de la fórmula Va. Con preferencia, se usan agentes de cloración o bromación tales como oxibromuro de fósforo, oxiclورو de fósforo, cloruro de tionilo, bromuro de tionilo o cloruro de sulfurilo. La reacción se puede llevar a cabo en sustancia o en presencia de un solvente. Las temperaturas de reacción usuales varían de 0 a 150° C o preferentemente de 80 a 125° C.



La reacción de Va con aminas VI se realiza bajo las condiciones descritas más arriba.

Los compuestos de la fórmula I, en la que X significa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, también se pueden preparar alternativamente a partir de los compuestos I, en donde X significa halógeno, en especial cloro y malonatos de la fórmula VIII. En la fórmula VIII, X' significa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y R significa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. Se hacen reaccionar en compuestos de la fórmula IX y se descarboxilan en compuestos I [compárese documento US 5.994.360].



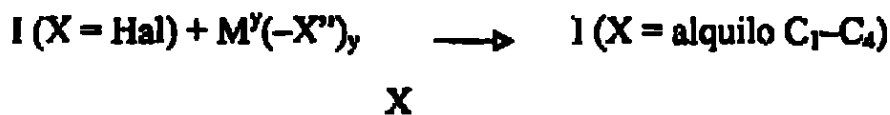
Los malonatos VIII se conocen de la bibliografía [J. Am. Chem. Soc., vol. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., vol. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, vol. 61, 1565 (1978)] o se pueden preparar de acuerdo con la literatura citada.

La posterior saponificación del éster IX se realiza bajo las condiciones usuales generales, en función de los diferentes elementos estructurales puede resultar ventajosa la saponificación alcalina o ácida de los compuestos IX. Bajo las condiciones de la saponificación del éster, se puede llevar a cabo la descarboxilación en I ya sea total o parcialmente.

La descarboxilación se lleva a cabo a temperaturas de 20° C a 180° C, preferentemente de 50° C a 120° C, en un solvente inerte, opcionalmente en presencia de un ácido.

Ácidos apropiados son ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido p-toluensulfónico. Solventes apropiados son agua, hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano y éter de petróleo, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, o-, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y clorobenceno, éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter ter.-butilmetílico, dioxano, anisol y tetrahidrofurano, nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, dietilcetona y ter.-butilmetilcetona, alcoholes tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y ter.-butanol, así como dimetilsulfóxido, dimetilformamida y dimetilacetamida, con preferencia especial, la reacción se lleva a cabo en ácido clorhídrico o ácido acético. También se pueden utilizar mezclas de los solventes mencionados.

También se pueden obtener compuestos de la fórmula I, en donde X es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, por acoplamiento con 5-halogenotriazolopirimidinas de la fórmula I, en la que X significa halógeno, con reactivos organometálicos de la fórmula X. En una forma de realización de este procedimiento, la reacción se lleva a cabo bajo catálisis con metales de transición, tales como catálisis con Ni o Pd.



En la fórmula X, M es un ion metálico de valencia Y, tal como por ejemplo B, Zn o Sn y X" es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>. Esta reacción se puede llevar a cabo, por ejemplo, de manera análoga a los siguientes métodos: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 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); ebenda, Vol. 33, 413 (1992).

Los compuestos de la fórmula I también se pueden preparar de modo alternativo partiendo de 6-cianofenil-triazolopirimidinas sustituidas de la fórmula XI.

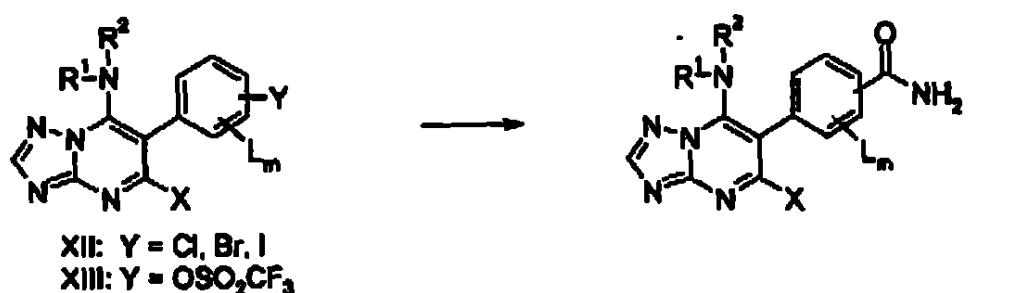


Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de ácido sulfúrico de 0 a 60°C, en especial de 20 a 25° C [compárese Synthetic Commun., 1999, pág. 547ff.], de modo alternativo, la reacción se puede realizar en el sistema de polietilenglicol / NaOH de 0 a 60° C, en especial de 20 a 25° C en presencia de un solvente o diluyente [compárese Synthetic Commun., 2000, pág. 1713ff.], o con urea / peróxido de hidrógeno de 0 a 60° C, en especial de 20 a 25°C en presencia de un solvente o diluyente [compárese Org. Lett. 1999, pág. 189ff.].

Los compuestos de la fórmula XI son conocidos del documento WO

03/080615 o bien se pueden preparar de acuerdo con la literatura citada.

Además, los compuestos de la fórmula I se pueden obtener por aminocarbonilación catalizada con Pd [compárese: Tetrahedron Lett. Vol. 39, 2835-2838 (1998); J. Org. Chem. Vol. 66, 4311 ff (2001); WO 00/37428; DE 35 25 564; J. Org. Chem. Vol. 62, 8640-8653 (1997); JP 2000191612) de los correspondientes compuestos halogenados XII [compárese el documento EP-A 550113] o triflatos XIII.



Las mezclas de reacción se elaboran de manera usual, por ejemplo por mezcla con agua, separación de fases y opcionalmente purificación cromatográfica de los productos brutos. Los productos intermedios y finales se producen en parte en forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente amarronados, que se liberan de partes volátiles o se purifican a presión reducida y a temperatura moderada. Una vez que se obtienen los productos intermedios y finales como sustancias sólidas, se puede realizar la purificación por recristalización o digestión.

Si no se puede acceder a los distintos compuestos I por las vías antes descritas, ellos se pueden preparar por derivación de otros compuestos I.

Si se producen mezclas isoméricas en la síntesis, en general no es

indispensable una separación, ya que los distintos isómeros se pueden convertir parcialmente entre sí durante la preparación para el uso o al ser usados (por ejemplo bajo la acción de la luz, un ácido o una base). También se pueden producir transformaciones después del uso, por ejemplo durante el tratamiento de plantas en la planta tratada o en el hongo dañino a combatir.

En el caso de las definiciones de los símbolos indicadas en las fórmulas anteriores se usaron términos colectivos que son representativos, en general, para los siguientes sustituyentes:

**Halógeno:** flúor, cloro, bromo y yodo;

**Alquilo:** radicales hidrocarbonados saturados, lineales o ramificados con 1 a 4, 6 u 8 átomos de carbono, por ejemplo alquilo  $C_1-C_8$  tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

**Halogenalquilo:** grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 2, 4 o 6 átomos de carbono (tal como se mencionó con anterioridad), en donde en estos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o completamente reemplazados por átomos de halógeno tal como se mencionó con anterioridad: en especial halogenalquilo  $C_1-C_2$  tales como

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, pentafluoroetilo o 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

Alquenilo: radicales hidrocarbonados insaturados, lineales o ramificados con 2 a 4, 6 u 8 átomos de carbono y uno o dos enlaces dobles en cualquier posición, por ejemplo alquenilo  $C_2-C_6$  tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-

butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

**Halogenalquenilo:** radicales hidrocarbonados insaturados, lineales o ramificados con 2 a 8 átomos de carbono y uno o dos enlaces dobles en cualquier posición (tal como se mencionó con anterioridad), en donde en estos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o completamente reemplazados por átomos de halógeno tal como se mencionó con anterioridad, en especial flúor, cloro y bromo;

**Alquínilo:** grupos hidrocarbonados de cadena lineal o ramificada con 2 a 4, 6 u 8 átomos de carbono y uno o dos enlaces triples en cualquier posición, por ejemplo alquínilo  $C_2-C_8$  tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

**Cicloalquilo:** grupos hidrocarbonados mono- o bicíclicos saturados

con 3 a 6 u 8 miembros de anillo de carbono, por ejemplo cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo;

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

- heterociclilo de cinco o seis miembros, que contiene uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o azufre, por ejemplo 2-tetrahidrofurano, 3-tetrahidrofurano, 2-tetrahidrotieno, 3-tetrahidrotieno, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropirano, 4-tetrahidropirano, 2-tetrahidrotieno, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo y 2-piperazinilo;

- heteroarilo de cinco miembros que contiene uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno: grupos heteroarilo de cinco miembros 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 u oxígeno como miembros de anillo, por

ejemplo 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;

— heteroarilo de seis miembros que contiene uno a tres o uno a cuatro átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo de seis anillos que, además de átomos de carbono, pueden contener uno a tres o uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros de anillo, por ejemplo 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 2-piridazinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo;

Alquileno: cadenas no ramificadas divalentes de 3 a 5 grupos de  $\text{CH}_2$ , por ejemplo  $\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$  y  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ;

Oxialquileno: cadenas no ramificadas divalentes de 2 a 4 grupos  $\text{CH}_2$ , en donde una valencia está unida a través de un átomo de oxígeno a la estructura, por ejemplo  $\text{OCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$  y  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ;

Oxialquilenoxi: cadenas no ramificadas divalentes de 1 a 3 grupos  $\text{CH}_2$ , en donde ambas valencias están unidas a través de un átomo de oxígeno a la estructura, por ejemplo  $\text{OCH}_2\text{O}$ ,  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$  y  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ .

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

Las formas de realización de especial preferencia de los productos intermedios respecto de las variables responden a las de los radicales I y

R<sup>3</sup> de la fórmula I.

Respecto del uso reglamentario de las triazolopirimidinas de la fórmula I, se prefieren especialmente los siguientes significados de los sustituyentes, para ser precisos solos o en combinación:

Se prefieren compuestos de la fórmula I, en donde R<sup>1</sup> no sea hidrógeno.

Se prefieren especialmente los compuestos I, en donde R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquénilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o halogenalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

Se prefieren los compuestos I, en donde R<sup>1</sup> es un grupo A:



en la que

Z<sup>1</sup> es hidrógeno, flúor o fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

Z<sup>2</sup> es hidrógeno o flúor, o

Z<sup>1</sup> y Z<sup>2</sup> forman juntos un enlace doble;

q es 0 o 1; y

R<sup>3</sup> es hidrógeno o metilo.

Además, se prefieren los compuestos I, en donde R<sup>1</sup> es cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, que puede estar sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

En especial se prefieren los compuestos I, en donde R<sup>2</sup> significa hidrógeno.

De igual manera se prefieren los compuestos I, en donde R<sup>2</sup> es metilo o etilo.

Siempre que  $R^1$  y/o  $R^2$  contengan grupos halogenoalquilo o halogenoalquenilo con un centro quiral, para estos grupos se prefieren los isómeros (S). En el caso de grupos alquilo o alquenilo libres de halógeno con un centro quiral en  $R^1$  o  $R^2$ , se prefieren los isómeros de configuración (R).

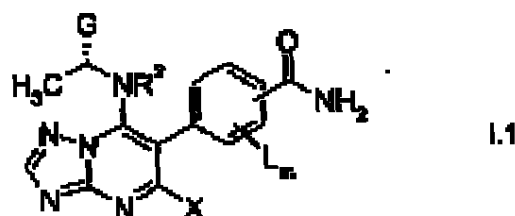
Además, se prefieren los compuestos I, en donde  $R^1$  y  $R^2$  forman, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un anillo piperidinilo, morfolinilo o tiomorfolinilo, en especial un anillo piperidinilo que está eventualmente sustituido con uno a tres grupos halógeno, alquilo  $C_1-C_2$  o halogenoalquilo  $C_1-C_4$ . Se prefieren en especial los compuestos, en los que  $R^1$  y  $R^2$  forman un anillo 4-metilpiperidina junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos.

Otro objeto preferido de la invención son compuestos I, en donde  $R^1$  y  $R^2$  forman un anillo pirazol junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, que está sustituido eventualmente con uno o dos grupos halógeno, alquilo  $C_1-C_4$  o halogenoalquilo  $C_1-C_4$ , en especial con 3,5-dimetilo o 3,5-di-(trifluorometilo).

Además, también se prefieren especialmente compuestos de la fórmula I, en donde  $R^1$  es  $CH(CH_3)-CH_2CH_3$ ,  $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$ ,  $CH(CH_3)-C(CH_3)_3$ ,  $CH(CH_3)-CF_3$ ,  $CH_2C(CH_3)-CH_3$ ,  $CH_2CH=CH_2$ , ciclopentilo o ciclohexilo;  $R^2$  es hidrógeno o metilo; o  $R^1$  y  $R^2$  junto con  $-(CH_2)_2CH(CH_3)(CH_2)-$ ,  $-(CF_2)_2CH(CF_3)(CH_2)_2$  o  $-(CH_2)_2O(CH_2)_2-$ .

Se prefieren los compuestos I, en donde X es halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , ciano o alcoxi  $C_1-C_4$ , tales como cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi, en especial cloro o metilo, en particular cloro.

Una forma de realización preferida de los compuestos de la fórmula 1 se refiere a compuestos de la fórmula I.1:



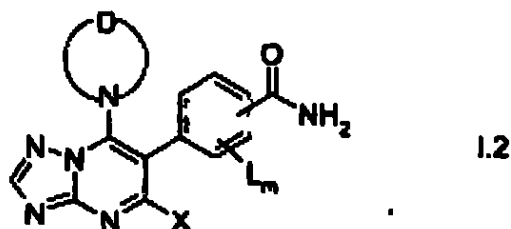
en la que

G es alquilo  $C_1-C_6$ , en especial etilo, n- e i-propilo, n-, sec-, ter- butilo, y alcoximetilo  $C_1-C_4$ , en especial etoximetilo, o cicloalquilo  $C_3-C_6$ , en especial ciclopentilo o ciclohexilo;

$R^2$  es hidrógeno o metilo; y

X corresponde a cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi.

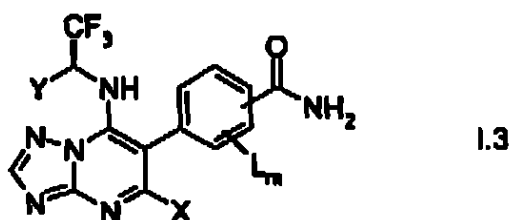
Otra forma de realización preferida de los compuestos de la fórmula 1 se refiere a compuestos, en donde  $R^1$  y  $R^2$  forman, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros que está unido a través de N y que puede contener otro heteroátomo del grupo O, N y S como miembro de anillo y/o uno o varios sustituyentes del grupo halógeno, alquilo  $C_1-C_6$ , halogenualquilo  $C_1-C_6$ , alquenilo  $C_2-C_6$ , halogenualquenilo  $C_2-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , halogenalcoxi  $C_1-C_6$ , alqueniloxi  $C_2-C_6$ , halogenualqueniloxi  $C_2-C_6$ , alquilenoxi  $C_1-C_6$  y oxialquilenoxi  $C_1-C_6$ . Estos compuestos corresponden en especial a la fórmula I.2



en la que

- D** forma, junto con el átomo de nitrógeno, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está unido a través de N y que puede contener otro heteroátomo del grupo O, N y S como miembro y/o uno o varios sustituyentes del grupo halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$  y halogenoalquilo  $C_1-C_2$ ; y
- X** es cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi.

Otra forma de realización preferida de realización de los compuestos de la fórmula I se refiere a compuestos de la fórmula 1.3

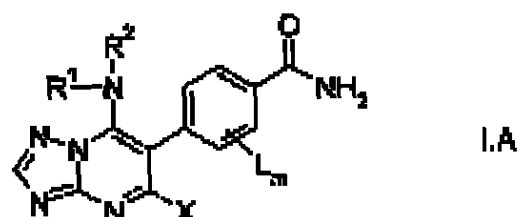


en la que Y es hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$ , en especial metilo y etilo, y X es cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi.

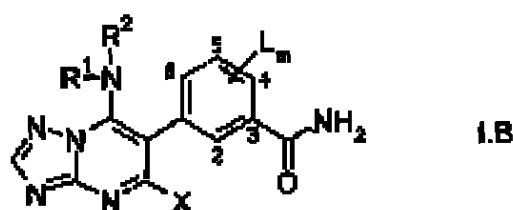
Se prefieren especialmente los compuestos de la fórmula I, en donde al menos un sustituyente está en posición orto respecto del enlace con la estructura de triazolopirimidina, en especial un sustituyente de cloro, flúor

o metilo.

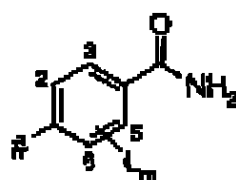
Otra forma de realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I, en la que el grupo  $C(O)NH_2$  está en posición 4; los compuestos responden a la fórmula I.A



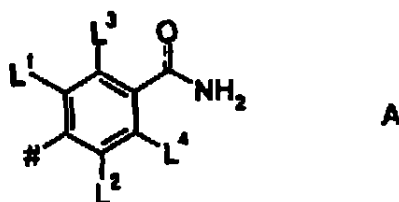
Otra forma de realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I, en la que el grupo  $C(O)NH_2$  está en posición 3; los compuestos responden a la fórmula I.B



Se prefieren especialmente los compuestos de la fórmula I.A, en la que el grupo fenilo



responde al grupo A:



en la que

$L^1$  es halógeno, halogenmetilo o alquilo  $C_1-C_4$ , en especial Cl, F o metilo;

$L^2, L^3, L^4$  son hidrógeno o halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , halogenalquilo  $C_1-C_4$  o alcoxi  $C_1-C_4$ ,

en donde # caracteriza el sitio de unión con la estructura de la triazolopirimidina.

En especial se prefieren los compuestos I reunidos en las siguientes tablas en lo que respecta a su uso. Los grupos mencionados en las tablas para un sustituyente representan en sí, independientemente de la combinación en la que están mencionados, una conformación de especial preferencia del sustituyente en cuestión.

#### Tabla 1

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A.

#### Tabla 2

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 3**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 4**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 5**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 6**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 7**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 8**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 9**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro-6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro-6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro-6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 12

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro-6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 13

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$

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

**Tabla 16**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 17**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 18**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 19**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 20**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 21**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un

compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 22**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 23**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 24**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 25**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 26**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 27**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 29

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,5-diflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,5-diflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 31

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,5 -diflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 32

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,5-diflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 33

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3,6-diflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 34

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 35

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 36

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 37

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 39

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 40

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$

corresponde a 2-cloro,5,6-diflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 41**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 42**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 43**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 44**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 45**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-triflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 46**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-triflúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un

compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 47**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-trifluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 48**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-trifluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 49**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-fluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 50**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-fluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 51**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-fluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 52**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-fluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 53**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 54**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 55**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 56**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 57**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 58**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 59**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 60**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 61**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,3-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 62**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,3-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 63**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,3-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 64**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,3-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 65**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$

corresponde a 2,5 -dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 66**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 67**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 68**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,5-dicloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 69**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-tricloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 70**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-tricloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 71**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-tricloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un

compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 72

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,3,6-tricloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 73

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 74

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 75

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 76

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 77

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 78**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 79**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 80**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 81**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 82**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 83**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 84**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 85**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 86**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 87**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 88**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 89**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 90**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$

corresponde a 2-cloro,5-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 91**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 92**

Compuestos de la fórmula I.A, en donde X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 93**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 94**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 95**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 96**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metilo,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$

corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 97**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,6-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 98**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6 dicloro,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 99**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,6-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 100**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 101**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 102**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 103**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 104**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 105**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,5-dimetilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 106**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,5-dimetilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 107**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,5-dimetilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 108**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,5-dimetilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 109**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 110**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 111**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 112**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 113**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 114**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 115**

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$

corresponde a 2-flúor,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 116

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 117

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 118

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 119

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 120

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,3-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 121

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$

corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 122

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 123

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,5-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 124

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,6-metoxi,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 125

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 126

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

#### Tabla 127

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,6-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 128

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 129

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 130

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 131

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluoro,3-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 132

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  2,6-difluoro,3-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 133

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

## Tabla 134

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 135

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 136

Compuestos de la fórmula I.A, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-metilo,5-metoxi y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

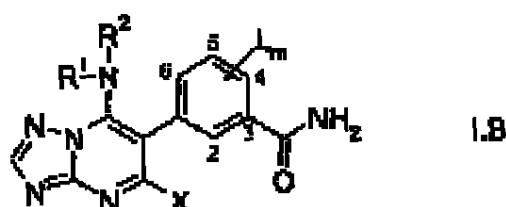


Tabla 137

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 138

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

Tabla 139

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 140**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 141**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 142**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 143**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 144**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 145**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$

corresponde a 2-cloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 146**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 147**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 148**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-cloro,6-flúor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 149**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 150**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 151**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un

compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 152**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-dicloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 153**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 154**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 155**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 156**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2,6-difluor y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 157**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 158**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 159**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 160**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 161**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 162**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 163**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 164**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 165**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  6-fluoro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 166**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 6-fluoro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 167**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 6-fluoro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 168**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 6-fluoro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 169**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 170**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$

corresponde a 2-flúor,6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 171**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 172**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 2-flúor,6-cloro y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 173**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a cloro,  $L_m$  corresponde a 6-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 174**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a ciano,  $L_m$  corresponde a 6-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 175**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metilo,  $L_m$  corresponde a 6-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un compuesto de una línea de la Tabla A

**Tabla 176**

Compuestos de la fórmula I.B, en la que X corresponde a metoxi,  $L_m$  corresponde a 6-metilo y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  corresponde a un

compuesto de una línea de la Tabla A Tabla A

| Nr.  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>2</sup>                                                  |
|------|-----------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|
| A-1  | H                                                               | H                                                               |
| A-2  | CH <sub>3</sub>                                                 | H                                                               |
| A-3  | CH <sub>3</sub>                                                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-4  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | H                                                               |
| A-5  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-6  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-7  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                 | H                                                               |
| A-8  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-9  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-10 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                                | H                                                               |
| A-11 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-12 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-13 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H                                                               |
| A-14 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-15 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-16 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-17 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H                                                               |
| A-18 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-19 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-20 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                                                               |
| A-21 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-22 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-23 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-24 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-25 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-26 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-27 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-28 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-29 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-30 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-31 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-32 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |

| Nr.  | R <sup>1</sup>                                             | R <sup>2</sup>                  |
|------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| A-33 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-34 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H                               |
| A-35 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-36 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-37 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H                               |
| A-38 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-39 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-40 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H                               |
| A-41 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-42 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-43 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | H                               |
| A-44 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-45 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-46 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | H                               |
| A-47 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-48 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-49 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | H                               |
| A-50 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-51 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-52 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | H                               |
| A-53 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-54 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-55 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | H                               |
| A-56 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-57 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-58 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | H                               |
| A-59 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-60 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-61 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | H                               |
| A-62 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-63 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-64 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | H                               |
| A-65 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-66 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |

| Nr.   | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>2</sup>                  |
|-------|-----------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| A-67  | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-68  | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-69  | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-70  | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | H                               |
| A-71  | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 |
| A-72  | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-73  | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | H                               |
| A-74  | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-75  | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-76  | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub>             | H                               |
| A-77  | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub>                 |
| A-78  | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub>             | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-79  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                              | H                               |
| A-80  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub>                 |
| A-81  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                              | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-82  | CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>                          | H                               |
| A-83  | CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>                          | CH <sub>3</sub>                 |
| A-84  | CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-85  | CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>         | H                               |
| A-86  | CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>         | CH <sub>3</sub>                 |
| A-87  | CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>         | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-88  | CH <sub>2</sub> -C≡CH                                           | H                               |
| A-89  | CH <sub>2</sub> -C≡CH                                           | CH <sub>3</sub>                 |
| A-90  | CH <sub>2</sub> -C≡CH                                           | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-91  | Ciclopentilo                                                    | H                               |
| A-92  | Ciclopentilo                                                    | CH <sub>3</sub>                 |
| A-93  | Ciclopentilo                                                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-94  | Ciclohexilo                                                     | H                               |
| A-95  | Ciclohexilo                                                     | CH <sub>3</sub>                 |
| A-96  | Ciclohexilo                                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-97  | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H                               |
| A-98  | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-99  | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-100 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -         |                                 |

| Nr.   | R <sup>1</sup>                                                                                   | R <sup>2</sup> |
|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|
| A-101 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -                         |                |
| A-102 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>2</sub> -                                     |                |
| A-103 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -           |                |
| A-104 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ClFCH <sub>2</sub> -                                            |                |
| A-105 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                            |                |
| A-106 | -CH <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                            |                |
| A-107 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -           |                |
| A-108 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                              |                |
| A-109 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                              |                |
| A-110 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                                                               |                |
| A-111 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                                               |                |
| A-112 | -CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                                                          |                |
| A-113 | -CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -                                          |                |
| A-114 | -CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                           |                |
| A-115 | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                     |                |
| A-116 | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                          |                |
| A-117 | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                         |                |
| A-118 | -(CH <sub>2</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                |
| A-119 | -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                          |                |
| A-120 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                         |                |
| A-121 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -                                                               |                |
| A-122 | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                                          |                |
| A-123 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -          |                |
| A-124 | -N=CH-CH=CH-                                                                                     |                |
| A-125 | -N=C(CH <sub>3</sub> )-CH=C(CH <sub>3</sub> )-                                                   |                |
| A-126 | -N=C(CF <sub>3</sub> )-CH-C(CF <sub>3</sub> )-                                                   |                |

Los compuestos de la fórmula I son apropiados como fungicidas. Se caracterizan por una excelente eficacia contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, en especial de la clase de los ascomicetes, deuteromicetes, oomicetes y basidiomicetes. En parte, actúan de modo sistémico y se pueden utilizar en fitosanidad como fungicidas de hojas y

suelos.

Tienen especial importancia para combatir un sinnúmero de hongos en diversos cultivos como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, bananas, algodón, soja, café, caña de azúcar, vino, plantas frutales y verduras como pepinos, chuuchas, tomates, papas y calabazas, así como en las semillas de estas plantas.

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes fitoenfemmedades:

- variedades de *Alternaria* en verduras y frutas,
- variedades de *Bipolaris* y *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
- *Blumeria graminis* (mildew) en cereales,
- *Botrytis cinerea* en frutillas, verduras, plantas de adorno y vides,
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaeroteca fuliginea* en calabazas,
- variedades de *Fusarium* y *Verticillium* en diversas plantas,
- variedades de *Mycosphaerella* en cereales, bananas y nueces,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Plasmopara viticola* en vides,
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- variedades de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- variedades de *Puccinia* en cereales,
- *Pyricularia oryzae* en arroz,
- variedades de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- *Uncinula necator* en vides,

- variedades de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, así como
- variedades de *Venturia* en manzanas y peras.

Los compuestos de la fórmula I se adecuan, además, para combatir hongos dañinos como *Paecilomyces variotii* en la protección de los materiales (por ejemplo, madera, papel, dispersiones para pintura, fibras o tejidos) y en la protección de las existencias.

Los compuestos de la fórmula I se usan tratando los hongos o las plantas, simientes, materiales o suelos que deben protegerse de la infección fúngica con una cantidad de principio activo de eficacia fungicida. La aplicación puede realizarse tanto antes como después de la infección de los materiales, las plantas o las semillas a través de los hongos.

Los agentes fungicidas contienen en general entre el 0,1 y el 95, preferentemente, entre el 0,5 y el 90 % en peso de principio activo.

Las cantidades de aplicación son -según el tipo de efecto deseado al aplicarlas en la fitoprotección - de entre 0,01 y 2,0 kg de principio activo por ha.

En el tratamiento de las simientes se usan, en general, cantidades de principio activo de 1 a 1000 g/100 kg de simiente, preferentemente, de 1 a 200 g/100 kg, en especial de 5 a 100 g/100 kg.

En la aplicación para la protección del material o de las existencias, la cantidad de aplicación de principio activo se orienta según el tipo de área de utilización y el efecto deseado. Las cantidades usuales de aplicación en la protección de los materiales son, por ejemplo, de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, de 0,005 g a 1 kg de principio activo por metro cúbico de

material tratado.

Los compuestos de la fórmula I pueden transformarse en las formulaciones convencionales, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. La forma de aplicación se orienta por el tipo de aplicación correspondiente; en cada caso debe garantizar una distribución fina y homogénea del compuesto de la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, por estiramiento del principio activo con solventes y/o vehículos, si se desea, usando emulsionantes y dispersantes. Como solventes / excipientes se tienen en cuenta esencialmente:

- agua, solventes aromáticos (por ejemplo, productos de Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo, fracciones de petróleo), alcoholes (por ejemplo, metanol, butanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo, ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido graso de dimetilo, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos. Básicamente también se pueden utilizar mezclas de solventes,
- vehículos tales como rocas pulverizadas naturales (por ejemplo, caolines, tierras arcillosas, talco, greda) y rocas pulverizadas sintéticas (por ejemplo, ácido silícico de alta dispersión, silicatos); emulsionantes tales como emulsionantes no ionógenos y aniónicos (por ejemplo, éteres de polioxietileno-alcohol graso, alquilsulfonatos y arilsulfonatos) y dispersantes tales como lejías de ligninsulfito y metilcelulosa.

Como sustancias tensioactivas se tienen en cuenta las sales alcalinas, las sales alcalinotérreas, las sales de amonio del ácido ligninsulfónico, nafalensulfónico, fenolsulfónico, dibutilnaftalensulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y glicoléteres de alcoholes grasos sulfatados, productos de condensación de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, productos de condensación de la naftalina o del ácido naftalensulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilenoctilfenoléter, isooctilfenol, octilfenol o nonilfenol etoxilados, alquilfenolpoliglicoléter, tributilfenilpoliglicoléter, alquilurilpoliéter – alcoholes, condensados de óxido etilénico de alcoholes y alcoholes grasos, aceite de ricino etoxilado, polioxietilenalquiléter, polioxipropileno etoxilado, acetal del éter poliglicólico del alcohol láurico, éster de sorbita, lejías residuales de ligninsulfito y metilcelulosa.

Para preparar soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite directamente pulverizables se usan fracciones de aceite mineral con un punto de ebullición de medio a alto, como el querosén o el aceite Diesel, además los aceites de alquitrán mineral así como los aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, el benceno, el tolueno, el xileno, la parafina, la tetrahidronaftalina, las naftalinas alquiladas o sus derivados, el metanol, el etanol, el propanol, el butanol, el ciclohexanol, la ciclohexanona, la isoforona, los solventes fuertemente polares como, por ejemplo, el dimetilsulfóxido, la N-metilpirrolidona o el agua.

Los polvos, los abrasivos y los desempolvantes pueden fabricarse

mezclando o moliendo las sustancias activas con un vehículo sólido.

Los granulados, por ejemplo los granulados para recubrimiento e impregnación y los homogéneos pueden prepararse por unión de los principios activos a los vehículos sólidos. Los vehículos sólidos son, por ejemplo, tierras minerales como gel de sílice, ácidos silícicos, silicatos, talco, caolín, carbonato de calcio, cal, creta, bolus alba, locss, arcilla, dolomita, tierra de infusorios, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, plásticos triturados, fertilizantes como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos vegetales como harina de cereales, harina de la corteza de los árboles, de la madera y de las cáscaras de las nueces, polvo de celulosa y otros vehículos sólidos.

Las formulaciones contienen en general del 0,01 al 95 % en peso, preferentemente del 0,1 al 90 % en peso de principio activo. Los principios activos se aplican en este caso en una pureza del 90 % al 100 %, preferentemente del 95 % al 100 % (según el espectro RMN).

Los ejemplos de las formulaciones son los siguientes:

1. Productos para diluir en agua

A Concentrados hidrosolubles (SL)

10 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en agua o en un solvente hidrosoluble. De modo alternativo, se añaden humectantes u otros excipientes. En la dilución en agua se disuelve el principio activo.

B Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en ciclohexanona añadiendo un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. Al diluir en agua, resulta una dispersión.

**C Concentrados emulsionables (EC)**

15 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en xileno, añadiendo dodecilmencensulfonato de Ca y etoxilato de aceite de ricino (5 % en cada caso). En la dilución en agua, resulta una emulsión.

**D Emulsiones (EAc, EAg)**

40 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en xileno, añadiendo dodecilmencensulfonato de Ca y etoxilato de aceite de ricino (5 % en cada caso). Esta mezcla se introduce en agua por medio de una máquina emulsionadora (Ultraturax) y se lleva a una emulsión homogénea. En la dilución en agua, resulta una emulsión.

**E Suspensiones (SC, OD)**

20 partes en peso de un compuesto según la invención se trituran añadiendo dispersantes y humectantes y agua o un solvente orgánico en un molino triturador de bolas con agitador en una fina suspensión de principios activos. En la dilución en agua, resulta una suspensión estable de principio activo.

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

50 partes en peso de un compuesto según la invención se trituran añadiendo

dispersantes y humectantes y se preparan por medio de equipos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de pulverización, lecho fluido) en forma de granulados dispersables o solubles en agua. En la dilución en agua, resulta una dispersión o solución estable de principio activo.

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

75 partes en peso de un compuesto según la invención se trituran añadiendo dispersantes y humectantes, así como gel de ácido silícico en un molino con rotor y estrator. En la dilución en agua, resulta una dispersión o solución estable del principio activo.

### **2. Productos para aplicación directa**

#### **H Polvos (DP)**

5 partes en peso de un compuesto según la invención se trituran finamente y se mezclan bien con caolin al 95 %. De esta manera se obtiene un desempolvante.

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

Se trituran finamente 0,5 partes en peso de un compuesto según la invención y se unen con 95,5 % de vehiculos. Procedimientos habituales en este caso son la extrusión, el secado por pulverización o el lecho fluido. Así se obtiene un granulado para aplicación directa.

#### **J Soluciones ULV (UL)**

10 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en un

solvente orgánico, por ejemplo xileno. De esta manera se obtiene un producto para aplicación directa.

Los principios activos pueden utilizarse como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación que se preparan a partir de ellas, por ejemplo, en forma de soluciones directamente pulverizables, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, despolvantes, abrasivos, granulados por espolvoreo, atomización, pulverización, disgregación o vertido. Las formas de utilización se orientan según las finalidades de aplicación; en cada caso deberán garantizar lo más posible la distribución más precisa de los principios activos según la invención.

Las formas de aplicación acuosas pueden prepararse a partir de concentrados de emulsiones, pastas o polvos humectables (polveros para pulverización, dispersiones en aceite) por agregado de agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias pueden homogeneizarse en agua como tales o disueltas en un aceite o en un solvente, por medio de humectantes, adhesivos, dispersantes o emulsionantes. Pero también a partir de la sustancia activa, los humectantes, los adhesivos, los dispersantes o los emulsionantes y eventualmente los solventes o el aceite, pueden prepararse concentrados resistentes, los cuales son apropiados para diluirse con agua.

Las concentraciones de principio activo en las preparaciones listas para usar pueden variar en amplios rangos. En general son de entre el 0,0001 y el 10 %, preferentemente entre 0,01 y 1 %.

Los principios activos también pueden utilizarse exitosamente en el procedimiento de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones con más del 95 % en peso de principio activo o incluso el principio activo sin aditivos.

A los principios activos pueden agregarse aceites de diverso tipo, humectantes, coadyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros agentes antiparasitarios, bactericidas, llegado el caso, recién directamente antes de la aplicación (mezcla en tanque). Estos agentes pueden agregarse a los agentes de la invención en una relación de pesos de 1 : 10 a 10 : 1.

Los agentes de la invención pueden existir en la forma de aplicación como fungicidas también junto con otros principios activos, por ejemplo, con herbicidas, insecticidas, reguladores del crecimiento, fungicidas o fertilizantes. Al mezclar los compuestos de la fórmula I o los agentes que los contienen en la forma de aplicación como fungicidas con otros fungicidas, se obtiene en muchos casos una ampliación del espectro de acción fungicida.

La siguiente lista de fungicidas, junto con los cuales se pueden usar los compuestos de la invención, debe detallar las posibilidades de combinación, pero sin limitarlas:

- acilalaninas tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo,
- derivados de amina tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminocadina, espiroxamina, tridemorf,
- anilinopirimidinas tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinilo,
- antibióticos tales como cicloheximida, griseofulvina, casugamicina,

natamicina, polioxina o estreptomicina,

- azoles tales como bixtanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloroaz, proxicconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol,
- dicarboximidas tales como iprodiona, niclozolina, procimidona, vinclozolina,
- diiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomilo, boscalida, carbendazim, carboxina, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, diuanona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotilano, mepronilo, nuarimol, probenazol, proquinazida, pirifenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, titluzanida, tiotánato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina,
- fungicidas de cobre tales como caldo de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato básico de cobre,
- derivados de nitrofenilo tales como binapacril, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,
- azufre,
- otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb,

carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, diclomezina, diclocimel, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexanida, fentin-acetato, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, foseúlo, foseúlo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propanocarb, talida, toloclofos-metilo, quintoceno, zoxamida,

- estrobilurinas tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, cruxoxima-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico tales como captafol, captano, diclofluanida, folpet, tolilfluanida,
- amidas de ácido cinámico y análogos tales como dimetomorfol, flumetover o flumorsl.

#### *Ejemplos de síntesis*

Las disposiciones reproducidas en los siguientes ejemplos de síntesis se utilizaron con la correspondiente modificación de los compuestos de partida para obtener otros compuestos I. Los compuestos obtenidos de esta manera se detallan en la tabla que figura más abajo con datos físicos.

**Ejemplo 1** - Preparación de 5-cloro-6-(2,6-difluoro-4-aminocarbonilfenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]primidina

Por medio de una solución de 1,5 mmol de 5-cloro-6-(2,6-difluoro-4-cianofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]primidina

[compárese el documento WO 03/80615] en 20 ml de metanol se introdujo gas HCl hasta saturación. Al cabo de 24 horas de agitar a aproximadamente 20–25° C se filtró el precipitado producido y se disolvió en diclorometano. Después de lavar con agua y de secar, se eliminó el solvente. A continuación de la cromatografía en gel de sílice, se obtuvieron 140 mg del compuesto que figura en el título con un punto de fusión de 197°C y 200 mg del éster metílico correspondiente con un punto de fusión de 176° C.

**Ejemplo 2 – Preparación de 5-metil-6-(2,6-difluor,4-aminocarbonilfenil)-7-(4-metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina**

**Etapa 2a: 5-(dimetilmalon-2-il)-6-(2,6-difluoro,4-cianofenil)-7-(4-metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina**

Una solución de 1 g (2,7 mmol) de 5-cloro-6-(2,6 difluoro,4-cianofenil)-7-(4metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5-a]pirimidina

[compárese el documento WO 03/80615] y 1 g de dimetilmalonato de sodio (6,5 mmol) en 10 ml de acetonitrilo se agitaron durante 4 horas a 70–80°C y durante 2,5 días a 20–25° C. En este caso se produjo un cuerpo sólido de color amarillo. Se filtró la mezcla de reacción sobre kieselguhr y se agitó el precipitado con una mezcla de ácido clorhídrico diluido y cloruro de metileno hasta la decoloración. Después de separar las fases, se extrajo la fase acuosa con cloruro de metileno. Una vez secadas las fases orgánicas combinadas y destilado el solvente, quedó 1 g del compuesto que figura en el título.

<sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, δ en ppm): 8,4 (s, 1H); 7,4 (d, 2H); 4,65 (s, 1H); 3,7 (s, 6H); 3,55 (d, ancho, 2H); 3,8 (t, ancho, 2H); 1,65 (d, ancho, 2H); 1,55 (m,

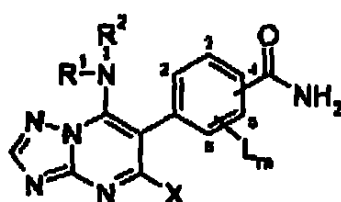
1 H); 1,3 (m, 2H); 0,95 (d, 3H).

**Etapla 2b:** 5-metil-6-(2,6-difluoro,4-aminocarbonilfenil)-7-(4-metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina

Una solución de 0,5 g (1,03 mmol) de 5-(dimetilmalon-2-il)-6-(2,6-difluoro,4-cianofenil)-7-(4-metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina y 0,3 g (3,8 mmol) de hidróxido de sodio al 50 % en 6 ml de metanol/agua (5:1) se calentó a reflujo durante 3 horas. Después de diluir con éter metil-*t*-butílico (MTBE) y ácido clorhídrico diluido se separó la fase orgánica y se extrajo la fase acuosa con MTBE. Las fases orgánicas combinadas se secaron y se liberaron del solvente. El residuo se purificó por medio de MPLC preparativa sobre gel de sílice RP-18 con mezclas de acetonitrilo/agua. Del eluato quedaron, después de separar el solvente, 0,11 g del compuesto que figura en el título en forma de resina amarilla.

$^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  en ppm): 8,35 (s, 1H); 7,8 (d, 2H); 7,7 (s, ancho, 1H); 6,75 (s, ancho, 1H); 3,65 (d, 2H); 2,8 (t, 2H); 2,35 (s, 3H); 1,6 (d, 2H); 1,5 (m, 1H); 1,3 (m, 2H); 0,9 (d, 3H).

Tabla I - Compuestos de la fórmula I



an

| Nº   | R <sup>1</sup>                                                                           | R <sup>2</sup> | X               | L <sub>m</sub>                            | Posición<br>CONH <sub>2</sub> | Datos físicos (P.f.<br>[°C]; <sup>1</sup> H-NMR δ<br>[ppm])                                                       |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|-----------------|-------------------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-1  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,6-F <sub>2</sub>                        | 4                             | 197                                                                                                               |
| I-2  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | CH <sub>3</sub> | 2,6-F <sub>2</sub>                        | 4                             | (Ej. 2b)                                                                                                          |
| I-3  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-F                                       | 4                             | 8,4 (s); 7,7 (m);<br>7,4 (t); 0,95 (d)                                                                            |
| I-4  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | 4                             | 130                                                                                                               |
| I-5  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 4                             | 162-164                                                                                                           |
| I-6  | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | 4                             | 240-241                                                                                                           |
| I-7  | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 4                             | 184                                                                                                               |
| I-8  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl,5-OCH <sub>3</sub>                   | 4                             | 190-191                                                                                                           |
| I-9  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,5-CH <sub>3</sub>                       | 4                             | 198-199                                                                                                           |
| I-10 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-F                    | 4                             | 215-216                                                                                                           |
| I-11 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-F                    | 4                             | 214-215                                                                                                           |
| I-12 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl                   | 4                             | 223-225                                                                                                           |
| I-13 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>5-OCH <sub>3</sub> | 4                             | 2 Atropoisómeros:<br>8,45; 8,4 (2s, 1H);<br>8,3; 8,35 (2s, 1H);<br>7,25; 7,1 (2s, 1H);<br>1,1; 1,0 (2d, 3H)       |
| I-14 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl                                      | 4                             | 247-249                                                                                                           |
| I-15 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-Cl                                      | 4                             | 2 Atropoisómeros:<br>8,35 (s, 1H); 8,15<br>(d, 1H); 7,95 (m,<br>1H); 7,55; 7,5 (2d,<br>1H); 1,05; 0,9 (2d,<br>3H) |
| I-16 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl                   | 4                             | 2 Atropoisómeros:<br>8,35 (s, 1H); 7,95;<br>7,9 (2s, 1H); 7,4;<br>7,35 (2s, 1H); 1,0<br>(d, 3H)                   |
| I-17 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl,5-CH <sub>3</sub>                    | 4                             | 205-208                                                                                                           |
| I-18 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-Cl,5-CH <sub>3</sub>                    | 4                             | > 250                                                                                                             |
| I-19 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 5                             | > 250                                                                                                             |
| I-20 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl                                      | 5                             | 8,3 (s); 8,0 (s);<br>7,9 (d); 7,5 (d); 0,9<br>(d)                                                                 |
| I-21 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 5                             | 223                                                                                                               |

| N°   | R <sup>1</sup>                                                                           | R <sup>2</sup> | X  | L <sub>m</sub>                            | Posición<br>CONH <sub>2</sub> | Datos físicos (P.f.<br>[°C]; <sup>1</sup> H-NMR δ<br>[ppm])                                                             |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|----|-------------------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-22 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | 246-247                                                                                                                 |
| I-23 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-Cl                                      | 5                             | 2 Atropoisómeros:<br>8,4; 8,3 (2s, 1H);<br>8,2 (2s, 1H); 8,1;<br>8,03 (2d, 1H); 7,65<br>(d, 1H); 1,05; 0,95<br>(2d, 3H) |
| I-24 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | Atropoisómero<br>polares (HPLC):<br>8,35 (s, 1H); 8,1 (s,<br>1H); 7,0 (s, 1H);<br>0,95 (d, 3H)                          |
| I-25 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | Atropoisómero no<br>polar (HPLC): 8,35<br>(s, 1H); 8,15 (s,<br>1H); 7,0 (s, 1H);<br>0,95 (d, 3H)                        |

*Ejemplos para la acción contra hongos dañinos*

El efecto fungicida de los compuestos de la fórmula general I se pudo mostrar por medio de los siguientes ensayos:

Los principios activos se prepararon como emulsión madre con principio activo al 0,25 % en peso en acetona o DMSO. A esta solución se añadió el emulsionante al 1 % en peso Uniperol® EL (humectante con acción emulsionante y dispersante a base de alquilfenoles etoxilados) y se diluyó con agua según la concentración deseada.

*Ejemplo de aplicación 1 – Eficacia contra la enfermedad de la cebada causada por Pyrenophora teres*

Se rociaron hojas de gérmenes de cebada crecidas en macetas de la especie "Hanna" hasta mojarlas con una suspensión acuosa en la concentración de principio activo dada más abajo. 24 horas después de seca

la capa rociada, las plantas de ensayo se inocularon con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora [sin. Drechslera] teres*, el agente patógeno de la enfermedad de la cebada. A continuación se colocaron las plantas de ensayo en invernadero a temperaturas que oscilaban entre 20 y 24° C y 95 a 100 % de humedad ambiente. Al cabo de 6 días, se calculó visualmente la extensión del desarrollo de la enfermedad en % de infección de toda la superficie de la hoja.

En este ensayo, las plantas tratadas con 63 ppm de los compuestos I-1 o I-25 mostraron sólo aproximadamente 3 % de infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en un 90 %.

**Ejemplo de aplicación 2 - Eficacia contra peronospora de la vid causada por *Plasmopara viticola***

Se rociaron hojas de vides en maceta de la especie "Riesling" con una suspensión acuosa hasta mojarlas, en la concentración de principio activo indicada más abajo. Al día siguiente se inocularon las caras inferiores de las hojas con una suspensión acuosa de zoosporas de *Plasmopara viticola*. Luego se colocaron las vides primero durante 48 horas en una cámara saturada con vapor de agua a 24° C y después durante 5 días en invernadero a temperaturas que oscilaban entre 20 y 30° C. Una vez transcurrido este tiempo, las plantas se colocaron en una cámara húmeda para acelerar la irrupción del portador de esporangios durante 16 horas. Luego se calculó visualmente la extensión del desarrollo de la infección en las caras inferiores de las hojas.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm del compuesto que figura en el título del Ejemplo 1 no presentan infección alguna, mientras

que las plantas no tratadas estaban infectadas hasta un 90 %.

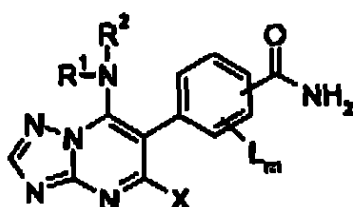
**Ejemplo de aplicación 3 – Eficacia contra botrytis en hojas de pimiento causada por *Botrytis cinerea* con uso protector**

Se rociaron semillas de pimiento de la especie "Neusiedler Idcal Elite", después de haberse desarrollado bien 2 a 3 hojas, con una suspensión acuosa hasta mojarlas, en la concentración de principio activo indicada más abajo. Al día siguiente se inocularon las plantas tratadas con una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea*, que contenía  $1,7 \times 10^6$  esporas/ml en una solución de malta biológica acuosa al 2 %. A continuación se colocaron las plantas de ensayo en una cámara climática con 22 a 24° C de temperatura, oscuridad y alta humedad ambiente. Al cabo de 5 días se pudo calcular visualmente la dimensión de la infección fúngica sobre las hojas en %.

En este ensayo, las plantas tratadas con 63 ppm de los compuestos I-2, I-14, I-23, I-24 o I-25 no presentaron más del 30 % de infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas hasta un 75 %.

## REIVINDICACIONES

1. Triazolopirimidinas caracterizadas porque tienen la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen el siguiente significado:

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> de modo independiente entre sí, hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halogencicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halogencicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o fenilo, naftilo o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> también pueden formar, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está unido a través de N y que puede contener uno a tres heteroátomos más del grupo O, N y S como miembro del anillo y/o que puede llevar uno o varios sustituyentes del grupo halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalcoksi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenalqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (exo) alquilenoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y oxi-alquilenoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

R<sup>1</sup> y/o R<sup>2</sup> pueden llevar uno a cuatro grupos R<sup>a</sup> iguales o diferentes:

$R^a$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo  $C_1-C_6$ , halogenalquilo  $C_1-C_6$ , alquilcarbonilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_2-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , halogenalcoksi  $C_1-C_6$ , alcoxicarbonilo  $C_1-C_6$ , alquiltio  $C_1-C_6$ , alquilamino  $C_1-C_6$ , di-alquilamino  $C_1-C_6$ , alquenilo  $C_2-C_6$ , halogenalquenilo  $C_2-C_6$ , cicloalquenilo  $C_2-C_6$ , alqueniloxi  $C_2-C_6$ , halogenalqueniloxi  $C_2-C_6$ , alquinilo  $C_2-C_6$ , halogenalquinilo  $C_2-C_6$ , alquiniloxi  $C_2-C_6$ , halogenalquiniloxi  $C_2-C_6$ , cicloalcoxi  $C_2-C_6$ , cicloalqueniloxi  $C_2-C_6$ , oxi-alquilenoxi  $C_1-C_3$ , fenilo, naftilo, heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S, en donde estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos pueden estar, a su vez, parcial o completamente halogenados o pueden llevar uno a tres grupos  $R^b$ :

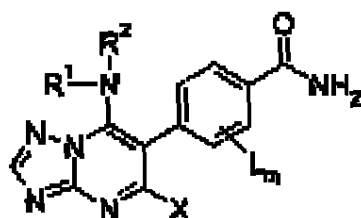
$R^b$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halogenalcoksi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxicarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, en donde los grupos alquilo en estos radicales contienen 1 a 6 átomos de carbono y los grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales contienen 2 a 8 átomos

de carbono;

y/o uno a tres de los siguientes radicales:

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterocicliloxi, en donde los sistemas cíclicos contienen 3 a 10 miembros de anillo; arilo, ariloxi, ariltio, aril-alcoxi  $C_1-C_6$ , aril-alquilo  $C_1-C_6$ , hetarilo, hetariloxi, hetariltio, en donde los radicales arilo contienen preferentemente 6 a 10 miembros de anillo, los radicales hetarilo contienen 5 o 6 miembros de anillo, en donde los sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos con grupos alquilo o haloalquilo;

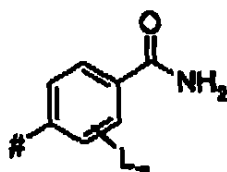
- L** es halógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_4$ , halogenaalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , alquenilo  $C_3-C_6$  o alcoxicarbonilo  $C_1-C_4$ ;
- m** 1, 2, 3 o 4, en donde los grupos **L** pueden ser diferentes cuando **m** es mayor que 1;
- X** es halógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_4$ , halogenaalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$  o halogenaalcoxi  $C_1-C_2$ .
2. Compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizados porque  $R^1$  no significa hidrógeno.
3. Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque tienen la fórmula I.A:



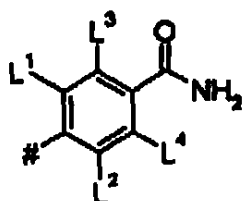
I.A

en la que las variables están definidas de acuerdo con la reivindicación 1.

4. Compuestos de la fórmula 1.A de acuerdo con la reivindicación 3, caracterizados porque el grupo fenilo



responde al grupo A:



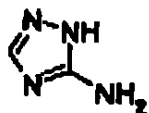
A

en la que

$L^1$  es halógeno, halogenmetilo o alquilo  $C_1-C_4$ ;

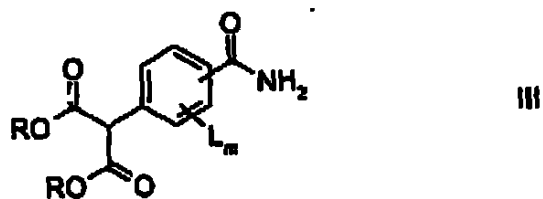
$L^2, L^3, L^4$  son hidrógeno o halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , halogenalquilo  $C_1-C_4$  o alcoxi  $C_1-C_4$ .

5. Procedimiento para preparar los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en la que X es halógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$  o halogenalcoxi  $C_1-C_4$ , caracterizado porque comprende la reacción del 5-aminotriazol de la fórmula II

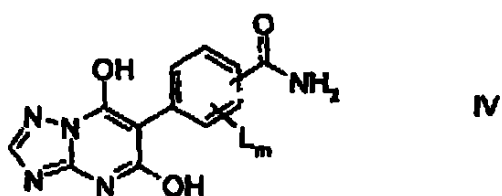


II

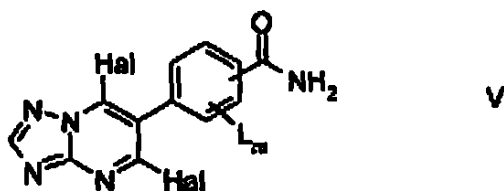
con fenilmalonatos de la fórmula III,



en la que R es alquilo, para dar dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV,



la halogenación para dar los compuestos dihalogenados de la fórmula V,



y la reacción de V con aminas de la fórmula VI

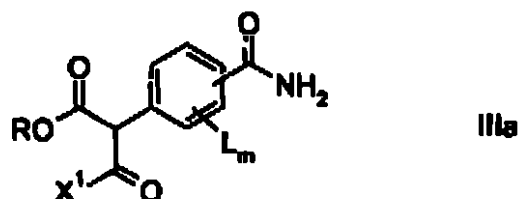


para dar los compuestos de la fórmula I, en la que X es halógeno, y si se desea para preparar compuestos I, en donde X es ciano, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o

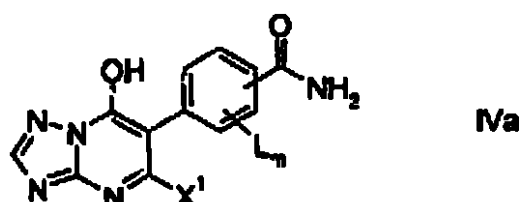
16.3



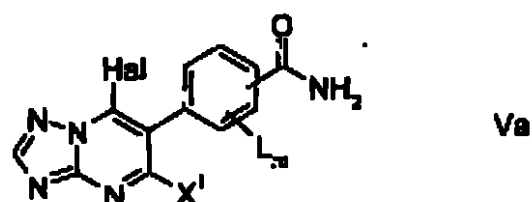
aminotriazol de la fórmula II de acuerdo con la reivindicación 5 con cetoésteres de la fórmula IIIa,



en la que  $X'$  es alquilo  $C_1-C_4$  o halogenalquilo  $C_1-C_4$  y R es alquilo  $C_1-C_4$ , para dar 5-alquil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas de la fórmula IVa



y la halogenación de IVa para dar 7-halogenotriazolopirimidinas de la fórmula Va



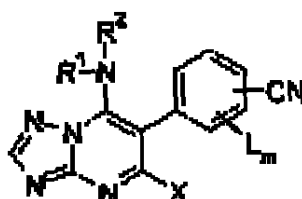
y la reacción de Va con aminas de la fórmula VI de acuerdo con la reivindicación 5 para obtener los compuestos I, en donde X es alquilo  $C_1-C_4$  o halogenalquilo  $C_1-C_4$ .

7. Compuestos intermediarios caracterizados porque tienen las

en

fórmulas IV, IVa, V y Va de acuerdo con las reivindicaciones 5 y 6.

8. Procedimiento para preparar compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la reacción de 6-cianofenil-triazolopirimidinas de la fórmula XI



XI

en presencia de ácido sulfúrico o en el sistema de polietilenglicol / NaOH o con urea / peróxido de hidrógeno.

9. Agente fungicida caracterizado porque contiene un vehículo sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1.

10. Simientes caracterizados porque contienen 1 a 1000 g de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 por 100 kg.

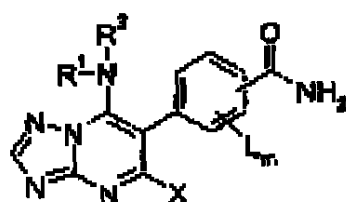
11. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se trata los hongos o los materiales, las plantas, el suelo o las simientes a proteger de una infección fúngica con una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1.

BUENOS AIRES, DICIEMBRE DE 2004.

## RESUMEN

**6-(AMINOCARBONIL-FENIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS,  
PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN Y SU USO PARA  
EL COMBATE DE HONGOS DAÑINOS, ASÍ COMO AGENTES  
QUE LAS CONTIENEN**

Triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen el siguiente significado:

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> hidrógeno, alquilo, halogenualquilo, cicloalquilo, halogencicloalquilo, alquenilo, halogenualquenilo, cicloalquenilo, halogencicloalquenilo, alquinilo, halogenualquinilo o fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> también pueden formar, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está unido a través de N y que contiene otro heteroátomo del grupo O, N y S como miembro del anillo y que puede estar sustituido de acuerdo con la descripción;

**L** halógeno, ciano, alquilo, halogenalquilo, alcoxi, alquenciloxi o alcóxicarbonilo;

**m** 1, 2, 3 o 4, en donde los grupos L pueden ser diferentes cuando m es mayor que 1;

**X** halógeno, ciano, alquilo, halogenalquilo, alcoxi o halogenalcóxi;

procedimientos y productos intermediarios para preparar estos compuestos, agentes que los contienen, así como su uso para el combate de hongos dañinos fitopatógenos.

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                           |                                                |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------|
| Abkürzungen des Anmelders oder Anwalts<br>000005E195                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | WEITERES VORGEHEN<br>siehe Formblatt PCT/ISA41G                           |                                                |
| Internationales Abkürzungen<br>PCT/EP2004/014393                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)<br>17.12.2004               | Prioritätsdaten (Tag/Monat/Jahr)<br>19.12.2003 |
| Internationale Patentsklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation nach IPC<br>INV. C07D487/04 A01N43/00                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                           |                                                |
| Anmelder<br>BASF AKTIENGESELLSCHAFT                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                           |                                                |
| <p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 35 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfasst insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen:</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (an der Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 507 der Verwaltungsvorschriften).</li> <li><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsinhalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</li> </ul> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl dieses elektronischen Dokuments angeben) : (kürze ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften)).</p> |                                                                           |                                                |
| <p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlagen des Berichts</li> <li><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</li> <li><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</li> <li><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 36(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</li> <li><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</li> <li><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</li> </ul>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                           |                                                |
| Datum der Einreichung des Antrags<br><br>29.06.2005                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | Datum der Fertigstellung dieses Berichts<br><br>12.04.2006                |                                                |
| Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde<br><br> Ernsthilches Patentamt - Mitscherlich Str. 203<br>D-10058 Berlin<br>Tel. +49 30 25901-0<br>Fax: +49 30 25901-540                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | Bevollmächtigter Bevollmächtigter<br><br>Hass, C<br>Tel. +49 30 25901-300 |                                                |



# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/014393

## Feld Nr. 1 Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der Sprache beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
  - ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
    - ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
    - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
    - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der Bestandteile\* der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt).

### Beschreibung, Seiten

1-49

in der ursprünglich eingereichten Fassung

### Ansprüche, Nr.

1-11

in der ursprünglich eingereichten Fassung

- ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
  - ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (genaue Angaben):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (genaue Angaben):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
  - ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (genaue Angaben):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (genaue Angaben):

\* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ergänzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT  
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/014393

**Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

- 1. Feststellung
  - Neuheit (N)
    - Ja: Ansprüche 1-11
    - Nein: Ansprüche
  - Erfinderische Tätigkeit (IS)
    - Ja: Ansprüche 1-11
    - Nein: Ansprüche
  - Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)
    - Ja: Ansprüche: 1-11
    - Nein: Ansprüche:

- 2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):
  - siehe Beiblatt

**Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen**

- 1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)
  - und / oder
- 2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)
  - siehe Beiblatt

### **Zu Punkt V**

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

#### **V.1 Zitierte Dokumente**

- D1: WO 03/080615 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETNER, CARSTEN; MUE) 2. Oktober 2003 (2003-10-02)
- D2: WO 03/080614 A (BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; BOIE, CHRISTIANE; DUNKEL, RALF;) 2. Oktober 2003 (2003-10-02)
- D3: WO 99/41255 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 19. August 1999 (1999-08-19)
- D4: WO 98/48608 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 22. Oktober 1998 (1998-10-22)
- D5: EP-A-0 071 792 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16. Februar 1983 (1983-02-16)
- D6: US-A-5 994 360 (PFRENGLE ET AL) 30. November 1999 (1999-11-30)
- D7: EP-A-0 770 615 (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2. Mai 1997 (1997-05-02)

Die angegebenen Bezeichnungen gelten für das gesamte Prüfungsverfahren.

#### **V.2 Neuheit**

Der Gegenstand des Anspruchs 1 unterscheidet sich von den Offenbarungen der Dokumente D1 bis D7 zumindest darin, dass im zitierten Stand der Technik keine Verbindungen beschrieben sind, bei denen die Aminogruppe des Amidorestes am Phenylring als unsubstituierte  $\text{NH}_2$ -Gruppe vorliegt. Der Gegenstand des Anspruchs 1 und damit auch der Ansprüche 2 bis 11 ist daher neu.

#### **V.3 Erfinderische Tätigkeit**

**V.3.1** Gemäß der Beschreibung ist die der Anmeldung zugrunde liegende Aufgabe darin zu sehen, fungizid wirkende Verbindungen bereitzustellen, die in ihrer Wirkung

gegenüber den als D1 bekannten strukturähnlichen Verbindungen verbessert sind.

V.3.2 D1 stellt den nächsten Stand der Technik dar. Die dort offenbarten Verbindungen sind strukturell den anmeldungsgemäßen Verbindungen sehr ähnlich, und sie sind ebenfalls als Fungizide vorgesehen. Der einzige strukturelle Unterschied besteht darin, dass die D1-Verbindungen an ihrer Phenylgruppe eine CO-NH(Alkyl)-Gruppe oder eine CO-N(Alkyl)<sub>2</sub>-Gruppe tragen können (in Tabelle 14 von D1 ist CO-NHCH<sub>3</sub> verifiziert), wohingegen die anmeldungsgemäßen Verbindungen immer die Gruppe CO-NH<sub>2</sub> tragen.

V.3.3 Die strukturelle Änderung gegenüber D1 liegt durchaus im Rahmen routinemäßiger Variationen des Fachmanns: Es scheint zunächst naheliegend, dass der Fachmann durch die in D1 angegebenen Möglichkeiten, nämlich N,N-Dialkylamido und N-Alkylamido, dazu angeregt wird, auch Verbindungen mit einer "freien" Amidogruppe auf ihre Wirkung hin zu überprüfen. Dass eine solche Strukturvariation zu verbesserter Wirkung führt, ist allerdings nicht zu erwarten - die Anmelderin hat aber eine solche Verbesserung durch Vergleichsversuche mit strukturnächsten D1-Verbindungen, die sich nur bezüglich der Amidogruppe von den anmeldungsgemäßen Verbindungen unterscheiden, glaubhaft gemacht. Die oben definierte technische Aufgabe wurde also gelöst; es wurde eine verbesserte Wirkung der anmeldungsgemäßen Verbindungen gegenüber dem nächsten Stand der Technik D1 gezeigt. Da diese Verbesserung der Aktivität gegenüber D1 nicht naheliegend ist, kann für den Gegenstand der Ansprüche 1-4 (Stoffansprüche) sowie 9-11 (Verwendungsansprüche) das Vorliegen erfinderischer Tätigkeit anerkannt werden.

V.3.4 Den Verfahrensansprüchen 5, 6 und 8 sowie dem auf Zwischenprodukte gerichteten Anspruch 7 kann ebenfalls erfinderische Tätigkeit zugesprochen werden, da die Zwischenprodukte durch die beanspruchten Verfahren zu Endprodukten umgesetzt werden, die von einem als erfinderisch angesehenen Anspruch 1 umfasst sind.

#### V.4 Gewerbliche Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-11 ist gewerblich anwendbar.

**Zu Punkt VI**

**Bestimmte angeführte Unterlagen**

**Bestimmte veröffentlichte Unterlagen**

| Anmelde Nr.<br>Patent Nr. | Veröffentlichungsdatum<br>(Tag/Monat/Jahr) | Anmeldedatum<br>(Tag/Monat/Jahr) | Prioritätsdatum<br>(zu Recht beansprucht)<br>(Tag/Monat/Jahr) |
|---------------------------|--------------------------------------------|----------------------------------|---------------------------------------------------------------|
| WO 2004/041824            | 21.05.2004                                 | 04.11.2003                       | 07.11.2002                                                    |

Dieses Dokument wurde nach dem Prioritätsdatum, aber vor dem Anmeldedatum der vorliegenden Anmeldung veröffentlicht. Es könnte zumindest bezüglich der Neuheitsfrage in der regionalen Phase vor dem EPA relevant werden.

Reino folio 179  
"Extucto"

| Expediente No                |                | No de Folio |
|------------------------------|----------------|-------------|
| Item                         | No de unidades |             |
| 1 CD                         |                |             |
| 2 DVD                        |                |             |
| 3 REVISTA                    |                |             |
| 4 LIBRO                      |                |             |
| 5 PERIODICO                  |                |             |
| 6 DISQUETES                  |                |             |
| 7 SOBRE DE MANILA            |                |             |
| 8 SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA  |                | 1           |
| 9 SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO |                |             |
| 10 OTROS:                    |                |             |

Observaciones:

Sobre con Ate Final

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
Rend: 06-059315-00000-0000  
Fec: 2006-06-16 17:57:11 Cap. 2020 NUESTRAS  
TAL 11 PATENTARI  
Ene. 279 FASE NACIONAL  
AC: 411 PRESENTACION Folio 175

RECIBO OFICIAL DE CASH : 06 - 44.160  
FECHA : JUNIO 12 DE 2006

RECIBO DE CONSIGNACION NIT

| DEPOSITANTE       | TIPO PAGO    | BANCO         | CUENTA      | Mo. PAGO | FECHA PAG  | Gr. PAGO      |
|-------------------|--------------|---------------|-------------|----------|------------|---------------|
| CAVELIER ANDRADAS | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | 050-00110-6 | 89274900 | 12/06/2006 | 26.485,000.00 |

RECIBO DE CONCEPTO NIT

| CANT. IDENTIFIC           | CONCEPTO                            | TOTAL CONCEPTO |
|---------------------------|-------------------------------------|----------------|
| 1 50003-01-01 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 CASH APLICADO AL EMPENDENTE No. \_\_\_\_\_

Glo 00361-241-108-0



477

176

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE  
PCT

PATENTE DE INVENCION



MODELO DE UTILIDAD [ ]

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente [X]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [X]
- ◆ Descripción de la invención [X]
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes [ ]
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [X]

COMPLETA [ ]

INCOMPLETA [ ]

DISEÑO INDUSTRIAL [ ]

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial [ ]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [ ]
- ◆ Representación gráfica 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 un Esquema de Trazado [ ]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [ ]
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado [ ]
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [ ]

COMPLETA [ ]

INCOMPLETA [ ]

Firma Responsable

Fecha 16 JUN. 2006

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10  
Conmutador: 3 82 08 40  
Fax: 350 52 20  
E-mail: [info@sic.gov.co](mailto:info@sic.gov.co)  
[www.sic.gov.co](http://www.sic.gov.co)  
Bogotá, D.C., Colombia

**REPUBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI**

177

Folios 128

2020  
Bogotá D.C.,

Doctor(a)  
FERRERO EMILIO  
Apoderado(a) y/o Representante de  
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

|            |                            |               |
|------------|----------------------------|---------------|
| REFERENCIA | Radicación No.             | 6 59315       |
|            | Solicitud internacional    | EP2004/014193 |
|            | Fecha inicio fase nacional | 19/07/2006    |
|            | Trámite                    | 11            |
|            | Evento                     | 379           |
|            | Actuación                  | 416           |
|            | Oficio No.                 | 972           |
|            | 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,

31 JUL 2006

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

adpall