

Q.P.



Industria y Comercio

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

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-59316

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

6-(2-HALOGENOFENIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS,

PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y EL USO

DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS,

ASI COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usáquén

22. BOGOTÁ, D. C.,



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 06-059316- 00000-0000

Fec: 2008-06-16 17:58:24 Dep. 2020 NUECREACIONES9

Tel. 11 PATENTENII

Eve: 379 FASENACIONALII

Adm 411 PRESENTACION

Fax 065 220

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

S LICITANTE

(71)

Nombre: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT

sociedad constituida y existente bajo las

leyes de: Republica Federal de Alemania

Dirección: 67056 Ludwigshafen,

República Federal de Alemania

Domicilio: Ludwigshafen,

República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE

O APODERADO

Nombre: EMILIO FERRERO

Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35

Teléfono: 347 36 11

Fax: 211 86 50

E-mail: clientes@camyp.com

Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 438.019 T.P 31.929

4

INVENTOR (ES)

(72)

1. Jordi TORMO I BLASCO

Carl-Benz-Strasse.10-3,

69514 Laudenbach,

República Federal de Alemania
2. Carsten BLETTNER

Richard-Wagner-Strasse.48,

68165 Mannheim,

República Federal de Alemania
3. Bernd MÜLLER

Stockingerstrasse. 7,

67227 Frankenthal,

República Federal de Alemania
4. Markus GEWEHR

Goethestrasse. 21,

56288 Kastellaun,

República Federal de Alemania
5. Wassilios GRAMMENOS

Alexander-Fleming-Strasse. 13,

67071 Ludwigshafen,

República Federal de Alemania
6. Thomas GROTE

Im Höhnhausen 18,

67157 Wachenheim,

República Federal de Alemania
7. Joachim RHEINHEIMER

Merziger Strasse.24,

67063 Ludwigshafen,

República Federal de Alemania
8. Peter SCHÄFER

Römerstrasse. 1,

67308 Ottersheim

República Federal de Alemania
9. Frank SCHIEWECK

Lindenweg 4,

67258 Hessheim,

República Federal de Alemania
10. Anja SCHWÖGLER

Heinrich-Lanz-Strasse. 3,

68165 Mannheim

República Federal de Alemania
11. Oliver WAGNER

Im Meisental 50,

67433 Neustadt

República federal de Alemania
12. Marla SCHERER

Hermann-Jürgens-Strasse.30,

76829 Godramstein

República Federal de Alemania
13. Siegfried STRATHMANN

Donnersbergstrasse. 9,

67117 Limburgerhof

República Federal de Alemania
14. Ulrich SCHÖFL

Erlenstrasse 8,

68782 Brühl,

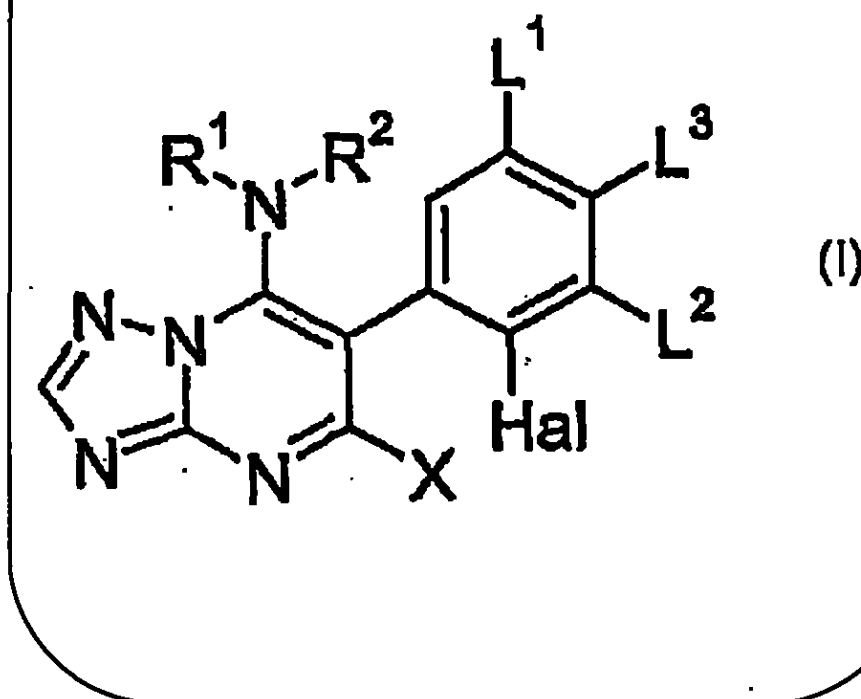
República Federal de Alemania

2

	15. Reinhard STIERL Jahnstrasse.8, 67251 Freinsheim, República Federal de Alemania		
5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/014328</u> Fecha: <u>16 de diciembre de 2004</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2005/058907 A1</u> Fecha: <u>30 de junio de 2005</u>		
6	TÍTULO (54) <u>6-(2-HALOGENOFENIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 487/04</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>DE</u> <u>DE</u>	(32) Fecha <u>18 de diciembre de 2003</u> <u>19 de abril de 2004</u>
			(31) Número de Solicitud <u>10360047.7</u> <u>10 2004 019 458.0</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>06 - 44.158</u> Fecha: <u>12 de junio de 2006</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.oo. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes, si fuere el caso. ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud. ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS		

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

Emilio Ferrero
C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2005/058907 A1

Descripción:

Páginas 62 en el idioma original

Páginas 89 en español

Reivindicaciones: Número (s) 10

Figuras: Número (s)

2. ☒ Traducción de los anexos del Reporte Internacional sobre Patentabilidad.

3. ☒ Extracto de publicación.

COLOMBIA

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República
Federal de Alemania

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

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

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

Firma

ppa. Welzel

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

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterschnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, República Federal de Alemania

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

Ausserdem, und unter diesen Regeln, wir verleihe den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentum zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uñs vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltung, streitigem Verwaltung, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Sammel-Defensiv- und Servicezeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen und -zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Namen und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertraglizenzen; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtmassnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbgerichtlichen Vertreter wahrnehmen.

Unterschnet heute am 17. März 1989 in D-6700 Ludwigshafen

09 JUN 2006

PABLO MENDEZ BARRALES

NOTARIO

Unterschrift

ppa. Richters

U.R.Nr. 1407/89

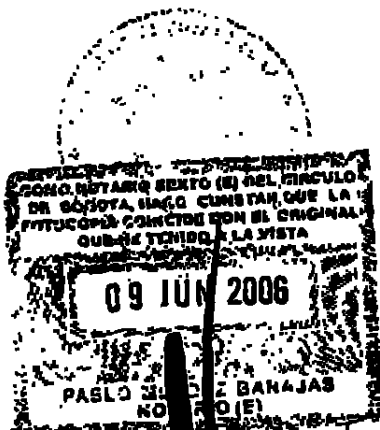
Ich beglaubige hiermit die Echtheit der vorst.
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren:

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

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

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

Ludwigshafen am Rhein, den 17. März 1989



Th. Walter
Notarassessor
am 17. März 1989
das Not. B. 3000 am 17. März 1989

Die Echtheit der vorstehenden Unterschrift des Notarassessors

Thomas Walter

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM

1. März 1989
17. März 1989

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

C E R T I F I C A:

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

Según F.O.S. 62 del Law E. E. U. K.



Mertha Niño de Staud
Mertha Niño de Staud
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, seguidamente autenticar la firma de éste.



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Deposito 24 ABR. 1966 No. 85061
PAIS: CHILE
El Sr. Martha Nino
cuyo firma aparece en el presente documento, declarando en este fecha que funciona en calidad de:

Martha Nino
ENCARGADO DE NEGOCIOS ACUÑA
Legación General

COMO NOTARIO SEXTO (S) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
09 JUN 2006
PAULO MENDEZ BARAJAS
NOTARIO (S)

881051599954



DECLARACION Y PAGO DEL

IMPUESTO D

TIMBR
NACIONAL

16 013 01 000045 1

16 013 01 000045 1

1 Administración de Impuestos de:		Código	2 Teléfono
BOGOTA		03	2120100
3 Documento de identificación (marque X)		4 Apellido y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres).	
C.C. & T.I. ☐ E ☐ NIT. ☐ A ☒ Y No.	D.V. ☐ 3	CAVELIER ABOGADOS	
860041367			
5		6 Apellido y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres).	
C.C. & T.I. ☐ C ☒ X NIT. ☐ A ☐ No.	D.V. ☐	BORERO ROCHA JAIME	
19'301.629			
7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4)	Municipio	Departamento	8 Número documento
Cra. 4a. No. 72-35	BOGOTA	CUNDINAMARCA	1

9 Relación al(los) tipo(s) de documento(s), incluyendo número, fecha, valor y naturaleza de la transacción.

TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989

PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER

COLO 0361-52-218-8

REVISADO

9 JUN 2006

ALDO MENDEZ BARAJAS
NOTARIO (E)

10 FIRMA

Responsable del pago

Nombre

C.C. No. 19'301.629

1 VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	750
2 Sanciones	0
3 Impuesto de mora	0
4 TOTAL A PAGAR (impuestos 1+2+3)	750
5	
6	
7	
8	
9	
10	
11	
12	
13	
14	
15	
16	
17	
18	
19	
20	
21	
22	
23	
24	
25	
26	
27	
28	
29	
30	
31	
32	
33	
34	
35	
36	
37	
38	
39	
40	
41	
42	
43	
44	
45	
46	
47	
48	
49	
50	
51	
52	
53	
54	
55	
56	
57	
58	
59	
60	
61	
62	
63	
64	
65	
66	
67	
68	
69	
70	
71	
72	
73	
74	
75	
76	
77	
78	
79	
80	
81	
82	
83	
84	
85	
86	
87	
88	
89	
90	
91	
92	
93	
94	
95	
96	
97	
98	
99	
100	

8

TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

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

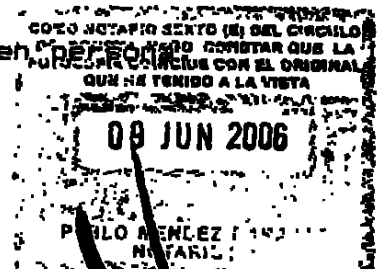
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

Protocolo notarial No. 1407/B9

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

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

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona



LUZ ARRAGA DE HERBEN
TRADUCCION OFICIAL
Bogotá No. 596 Minutaria

9

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

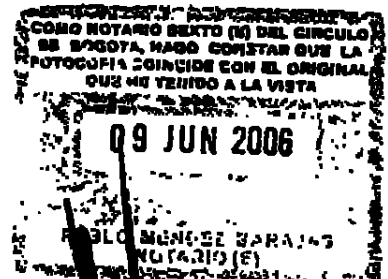
Notario de Ludwigshafen

Th. Walter

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

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

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



El Presidente del Tribunal Regional

Fdn.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20,-- DM

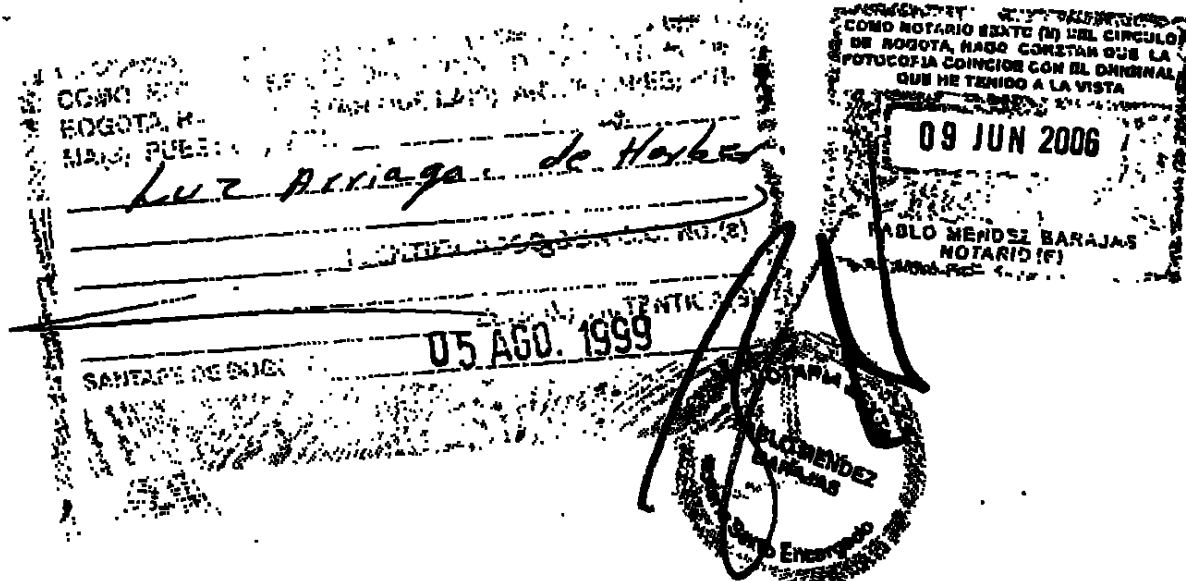
EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas anteriores por el
Consulado de General de Colombia en Frankfurt, bajo el No.
0077 (Certificación consular) del 6 de abril de 1989 y del
Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia bajo el No.
85061 del 24 de abril de 1989.

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00.

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

Bogotá, 26 de abril de 1989 .

LUZ ARRIAGA DE HERZEN
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Luz Arriaga de Herzen
Registación No. 599 Municipal



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 28 FEB 1963 No. 89045
HAYE COPIES
Cruz de Herra
cuyo fin es para el proceso
documental, desde el día en que se
ha cumplido el trámite.

09 JUN 2006

PABLO MENDEZ GARAJA
NOTARIO (E)

11
CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No. 72-35

BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

TELEFONO (57) (1) 2170100

CABLES: CAVELEYES

Señor Jefe de la

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E.

S.

D.

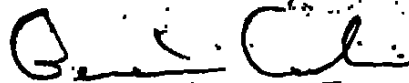
Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

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

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

Señor Jefe,

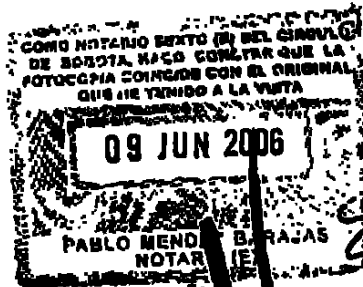


GERMAN CAVELIER.

T.P.A. No. 832

C. No. 2.877.924 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. 1º, del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá, compareció, el Doctor Samir Franco

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 4729298
expedida en Venezuela y la tarjeta profesional
número 31.729 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: D. P. MUÑOZ (abogado)
y declaró que la firma que aparece en el 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. 1º, del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá, compareció, el Doctor Samir Franco

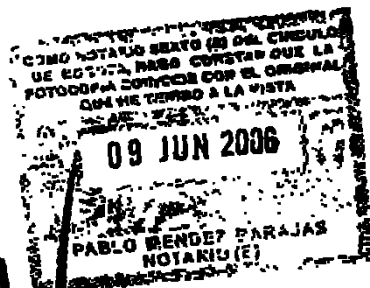
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 2077924
expedida en Venezuela y la tarjeta profesional
número 637 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación
y declaró que la firma que aparece en el es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



[Handwritten signature]

CESION

ASSIGNMENT

>

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach
Germany
Citizen of Spain
Carsten Bleitner
Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller
Stockingerstr.7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Thomas Grote
Im Höhenhausen 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 Hefenheim
Germany
Citizen of Germany
Anja Schwögl
Heinrich-Lunz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

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

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

6-(2-halogenofenil)-triazolopirimidinas,
 procedimientos para su preparación y el
 uso de las mismas para combatir hongos
 nocivos, así como productos que las
 contienen.

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

Germany

domiciliada en

67056 Ludwigshafen am Rhein, Germany

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

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

6-(2-halophenyl)triazolopyrimidines,
 method for their production and their
 use for combating pathogenic fungi, in
 addition to agents containing said
 substances.

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 am Rhein, 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.

CAVELIER ABOGADOS

WPPODERE-343

CO Assignment Form (01 11/98)

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


Jordi Tormo i Blasco


Carsten Blettner


Bernd Müller


Markus Geyhr


Wassilios Grammenos

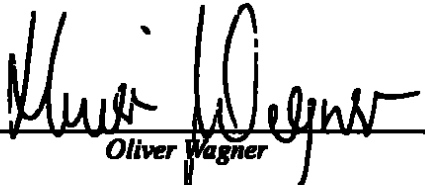

Thomas Grote


Joachim Rheinheimer

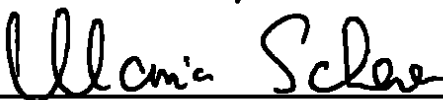

Peter Schäfer


Frank Schieweck


Anja Schwögl



Oliver Wagner



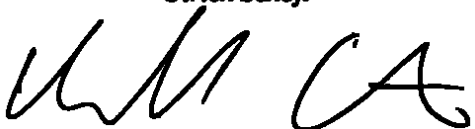
Maria Scherer



Siegfried Strathmann



Ulrich Schöft



Reinhard Stierl

Urk.R.Nr. 1624/2004

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 **Tormo i Blasco**, residing at Carl-Benz-Straße 10-3, 69514 Laudenbach, , 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, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Straße 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
6. Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Höhnhausen 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 19th day of July, 2004



Notary Public

Wert: 5.112,92 Euro

A P O S T I L L E

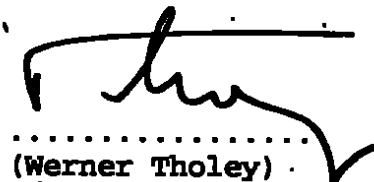
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

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

9. Siegel/Stempel; 10. Unterschrift


.....
(Werner Tholey)

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

AUTENTICACION NOTARIAL (INDIVIDUO) NOTARIAL AUTHENTICATION (INDIVIDUAL)

A los días del mes de de 200 On this 19th day of July 2004

ante mí, Notario Público de before me, a Notary Public of at Ludwigshafen,
compareció(eron) personalmente Federal Republic of Germany
personally appeared

Jordi Tormo i Blasco, Carsten Blettner,
Bernd Müller, Markus Gewehr,
Wassilios Grammenos, Thomas Grote,
Joachim Rheinheimer, Peter Schäfer,
Frank Schieweck, Anja Schwögler,
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) to me known, and known to me to be the person(s) who
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y executed that foregoing document, and who has-(have)
quien(es) tiene(n) capacidad legal para otorgarlo. legal capacity to execute it.



Notario Público Notary Public

Notarization and legalized by means of Apostille

CAVELIER ABOGADOS
WFFODERE-343

A P O S T I L L E

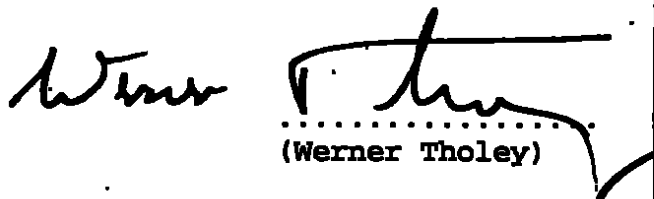
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

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

9. Siegel/Stempel: 10. Unterschrift


.....
(Werner Tholey)



Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

TRADUCCIÓN OFICIAL 126/2006 DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL APROBADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE LA REPÚBLICA DE COLOMBIA Y MEDIANTE EL CUAL **JORDI TORMO I BLASCO, CARL-BENZ-STR. 10-3, 69514 LAUDENBACH, ALEMANIA, CIUDADANO ESPAÑOL; y otros (Ver lista completa en la autenticación que aparece más adelante)**, DECLARAN BAJO JURAMENTO SER LOS ÚNICOS Y VERDADEROS INVENTORES DE LA INVENCION 6-(2-halogenofenil)-triazolopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como los productos que las contienen, Y DECLARAN POR EL PRESENTE QUE CEDEN Y TRANSFIEREN SIN LIMITACIÓN DICHA INVENCION A **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**, EMPRESA ORGANIZADA Y EXISTENTE BAJO LAS LEYES DE ALEMANIA, DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, JUNTO CON TODOS LOS DERECHOS INHERENTES Y QUE DICHA COMPAÑÍA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE EN LA REPÚBLICA DE COLOMBIA.

DADO Y FIRMADO HOY 19 de julio de 2004.

15 FIRMAS ILEGIBLES, CORRESPONDIENTES A JORDI TORMO I BLASCO y otros y que se enumeran a continuación.

FIRMADO: NOTARIO PÚBLICO

U.R NR. 1624/2004

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

1. **JORDI TORMO I BLASCO, residente en CARL-BENZ-STR. 10-3, 69514 LAUDENBACH, ALEMANIA, personalmente conocido mío;**
2. **CARSTEN BLETTNER, residente en RICHARD-WAGNER-STR 48, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA, personalmente conocido mío;**

3. **BERND MÜLLER** residente en **STOCKINGERSTR. 7, 67227 FRANKENTHAL, ALEMANIA**, personalmente conocido mío
4. **MARKUS GEWEHR**, residente en **GOETHESTR. 21, 56288 KASTELLAUN, ALEMANIA**, personalmente conocido mío;
5. **WASSILIOS GRAMMENOS** residente en **ALEXANDER-FLEMING-STR. 13, 67071 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA**, personalmente conocido mío;
6. **THOMAS GROTE IM HOEHNHAUSEN 18, 67157 WACHENHEIM, ALEMANIA**, personalmente conocido mío
7. **JOACHIM RHEINHEIMER**, residente en **MERZIGER STR. 24, 67063, LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA**, personalmente conocido mío;
8. **PETER SCHÄFER**, residente en **RÖMERSTR.1, 67308 OTTERSHEIM, ALEMANIA**, personalmente conocido mío
9. **FRANK SCHIEWECK**, residente en **LINDENWEG 4, 67258 HESSHEIM, ALEMANIA**, personalmente conocido mío
10. **ANJA SCHWÖGLER**, residente en **HEINRICH-LANZ-STR. 3, 68165 MANNHEIM, ALEMANIA**, personalmente conocido mío;
11. **OLIVER WAGNER**, residente en **Im MEISENTAL 50, 67433 NEUSTADT, ALEMANIA**, personalmente conocido mío;
12. La señora **MARÍA SCHERER**, residente en **Hermann-Jürgens-Strasse 30, 76829 Godramstein, Alemania**, personalmente conocida mía
13. **SIEGFRIED STRATHMANN, DONNERSBERGSTR. 9, 67117 LIMBURGERHOF, ALEMANIA**, personalmente conocido mío;
14. **ULRICH SCHÖFT**, residente en **Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania**, personalmente conocido mío:
15. **REINHARD STIERL JAENSTR. 8, 67251 FREINSHEIM, ALEMANIA**, personalmente conocido mío,

son verídicas y válidas

Ludwigshafen/Rhine, 19 de julio de 2004.

Firma ilegible

Sello realzado fijado sobre plástico blanco, con leyenda ilegible

E hilo que lo une al resto del documento.

APOSTILLA con número 91 Eb-922-995/04

COLO-361-841-104-9

WPCL002G ID 7774

Bogotá, 11 de mayo de 2006.

Edmundo Calade
Edmundo Calade Riquelme
"TRADUCTOR OFICIAL"
ESPAÑOL - ESPAÑOL
Res. 541. Febrero de 1970

RECEIVED
MAY 11 2006
MAY 11 2006

RECEIVED
MAY 11 2006
MAY 11 2006

TRADUCCION OFICIAL No. 11354

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

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

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

LUZ ARIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

-Oliver Wagner
Im Melsental 50, 67433 Neustadt, Alemania
Ciudadano de Alemania
- Maria Scherer
domiciliada en Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein, Alemania
Ciudadana de Alemania
- Siegfried Strathmann,
domiciliado en Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof, Alemania,
Ciudadano de Alemania,
- Ulrich Schöff
domiciliado en Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania
Ciudadano de Alemania
- 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-(2-halogenofenil)-triazolopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen.

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Hay 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 (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.

JOZ ARRIAGA DE HERRERA
TRADUCCION E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer
3. Actuando en calidad de notario público
4. Lleva el sello oficial del notario Draxel-Fischer,
notario de Ludwigshafen am Rhein

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 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 por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 19 de julio de 2004, bajo el No. 1624/2004. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros

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

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer

3. Actuando en calidad de notario público

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

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)

6. el 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, 10 de mayo de 2006

c. 3500

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Luz Arriaga de Herber
Resolución No.598 Min. Justicia

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
30. Juni 2005 (30.06.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/058907 A1

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/014328

(22) Internationales Anmeldedatum:
16. Dezember 2004 (16.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10360047.7 18. Dezember 2003 (18.12.2003) DE
10 2004 019 458.0 19. April 2004 (19.04.2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungstaaten mit Ausnahme
von US): BASF AKTIENGESellschaft [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

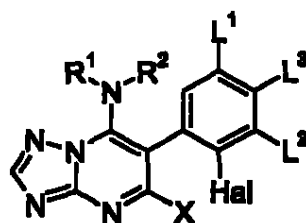
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO,
Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach

(DE). BLETNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wag-
ner-Str.48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd
[DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE).
GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288
Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wastilos [GR/DE];
Alexander-Flaming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).
GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hühnhansen 18, 67157
Wachenheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE];
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER,
Peter [DE/DE]; Römerstr.1, 67308 Ottersheim (DE).
SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258
Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Hein-
rich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). WAGNER,
Oliver [DE/DE]; Im Malsental 50, 67433 Neustadt (DE).
SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30,
76829 Godramstein (DE). STRATHMANN, Siegfried
[DE/DE]; Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE).
SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Brienstr. 8, 68782 Brühl
(DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251
Freinsheim (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 6-(2-HALOPHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION AND THEIR USE FOR
COMBATING PATHOGENIC FUNGI, IN ADDITION TO AGENTS CONTAINING SAID SUBSTANCES

(54) Bezeichnung: 6-(2-HALOGENPHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND
IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(I)

(57) Abstract: The invention relates to triazolopyrimidines of formula (I) in which
the substituents are defined as follows: R¹, R² represent 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, containing one to four heteroatoms
from the group O, N or S; R¹ and R², together with the nitrogen atom, to which
they are bonded, can also form a five- or six-membered heterocyclol or heteroaryl,
which is bonded via N, can contain an additional heteroatom from the group O, N
and S as a ring member and can be substituted according to the description; L¹, L²

represent hydrogen, cyano, haloalkyl, alkoxy, alkenyloxy or C(=O)A, whereby at least one group L¹ or L² does not represent
hydrogen; A represents hydrogen, hydroxy, alkyl, alkoxy, haloalkoxy, C₁-C₆ alkylamino or dialkylamino; L³ represents hydrogen,
halogen, cyano, nitro, haloalkyl, alkoxy or alkoxycarbonyl; X represents halogen, cyano, alkyl, haloalkyl, alkoxy or haloalkoxy.
The invention also relates to methods and intermediate products for producing said compounds, to agents containing the latter and
to their use for combating plant-pathogenic fungi.

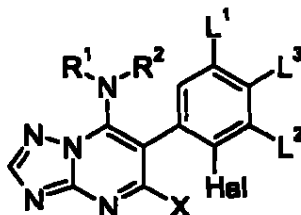
(57) Zusammenfassung: Triazolopyrimidine der Formel (I) in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R¹, R² Wasser-
stoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenocycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogenocycloalkenyl, Alkynyl,
Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Hete-
rocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom,
an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclol 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 kann; L¹, L²
Wasserstoff, Cyano, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy oder C(=O)A, wobei mindestens eine Gruppe L¹ oder L² ungleich Wasser-
stoff ist; A Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylamino oder Dialkylamino; L³ Wasserstoff, Halogen,
Cyano, Nitro, Halogenalkyl, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl; X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy;
Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämp-
fung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2005/058907 A1

6-(2-Halophenyl)triazolopyrimidines, 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 R¹, R² independently of one another are hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₃-C₈-halocycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-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
- 15 O, N and S,

- R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a five- or six-membered heterocycliyl or heteroaryl which is attached via N and may contain one to three further heteroatoms from the group consisting of O,
- 20 N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-haloalkoxy, C₃-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-haloalkenyloxy, C₁-C₈-alkylene and oxy-C₁-C₈-alkyleneoxy;

- 25 R¹ and/or R² may carry one to four identical or different groups R^a:

- R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-haloalkoxy, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-alkylthio, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino,
- 30 C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-haloalkenyloxy, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-alkynyloxy, C₃-C₈-haloalkynyloxy, C₃-C₈-cycloalkoxy, C₃-C₈-cycloalkenyloxy, C₁-C₃-oxyalkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four
- 35 heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

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 :

5 R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy, alkoxy carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothio-
10 carbonyl, 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;

15 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
20 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;

25 Hal is halogen;

L^1, L^2 are hydrogen, cyano, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_3-C_6 -alkenyloxy or $C(=O)A$, where at least one group L^1 or L^2 is not hydrogen;

30 A is hydrogen, hydroxy, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_1-C_6 -haloalkoxy, C_1-C_6 -alkylamino or di- $(C_1-C_6$ -alkyl)amino;

L^3 is hydrogen, halogen, cyano, nitro, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_1-C_6 -alkoxycarbonyl;

35 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.

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-Phenyltriaazolopyrimidines whose phenyl group may, in the para-position, carry an alkylamide group are proposed in a general manner in WO 03/080615. It is known that these compounds are suitable for controlling harmful fungi.

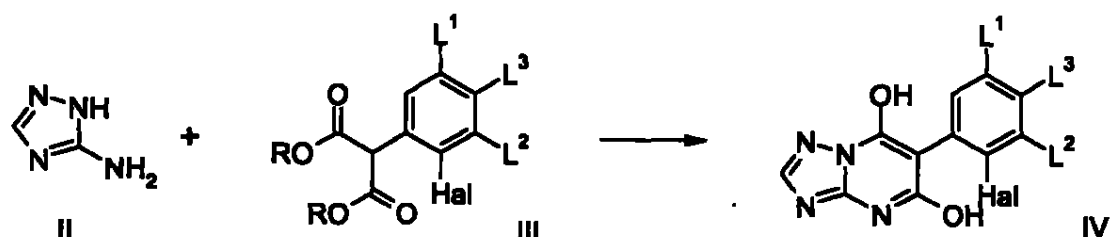
The compounds according to the invention differ from those described in WO 03/080615 by the position of the alkylamide group as a substituent of the 6-phenyl ring.

However, the action of the prior-art compounds is in many cases unsatisfactory.

It is an object of the present invention to provide compounds having improved activity and/or a broader activity spectrum.

We have found that this object is achieved by the compounds defined at the outset. Furthermore, we have found processes and intermediates for their preparation, compositions comprising them and methods for controlling harmful fungi using the compounds I.

The compounds according to the invention can be obtained by different routes. Advantageously, they are prepared by reacting 5-aminotriazole of the formula II with appropriately substituted phenylmalonates of the formula III in which R is alkyl, preferably C₁-C₆-alkyl, in particular methyl or ethyl.



This reaction is usually carried out at temperatures of from 80°C to 250°C, preferably from 120°C to 180°C, in the absence of a 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), 81ff.

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. The reaction is particularly preferably 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.

5

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

10

particular alkali metal alkyls, alkylmagnesium halides and also alkali metal and alkaline earth metal alkoxides and dimethoxymagnesium, moreover organic bases, for example tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, trisopropylamine, tributylamine and N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, pyridine, substituted pyridines, such as collidine, lutidine and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic amines. Particular

15

preference is given to tertiary amines such as trisopropylamine, 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 solvents.

20

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

25

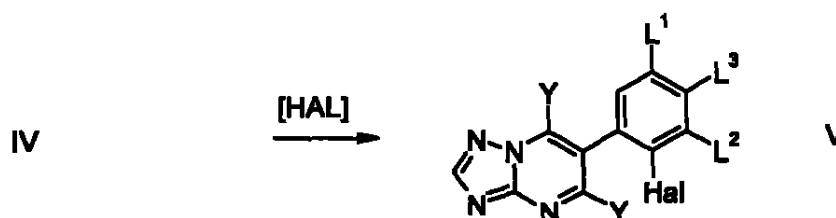
Phenylmalonates of the formula III are advantageously obtained by reacting appropriately substituted bromobenzenes with dialkyl malonates under Cu(I) catalysis [cf. Chemistry Letters (1981), 367-370; EP-A 10 02 788].

30

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

35

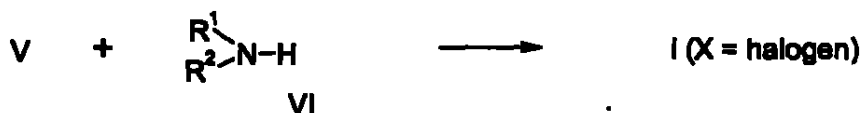
5



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

5

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



- 10 In which R¹ and R² are as defined in formula I, to give compounds of the formula I in which X is halogen.

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 98/46608].

15

Preference is given to using a base, such as a tertiary amine, for example

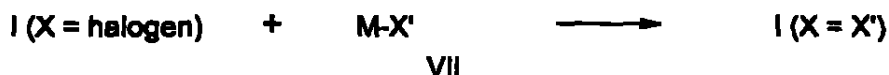
20

triethylamine, or an inorganic base, such as potassium carbonate; it is also possible for excess amine of the formula VI to serve as base.

Compounds of the formula I in which X is cyano, C₁-C₂-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy can advantageously be obtained 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, preference is usually given to ammonium, tetraalkylammonium or alkali metal or alkaline earth metal salts.

25

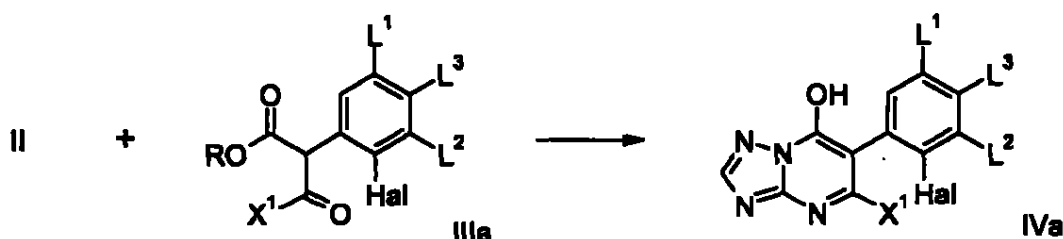
30



The reaction temperature is usually from 0 to 120°C, preferably from 10 to 40°C [cf. J. Heterocycl. Chem. 12 (1975), 861-863].

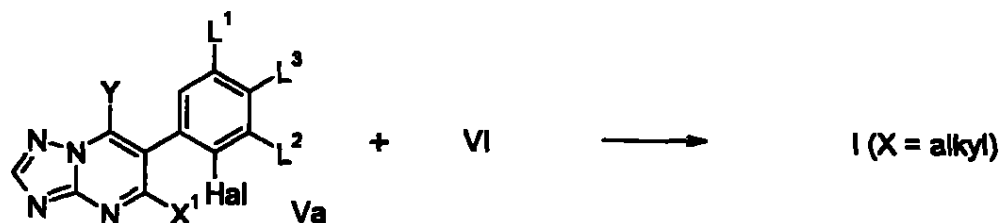
- 5 Suitable solvents include ethers, such as dioxane, diethyl ether and, preferably, tetrahydrofuran, alcohols, such as methanol or ethanol, halogenated hydrocarbons, such as dichloromethane, and aromatic hydrocarbons, such as toluene or acetonitrile.

- 10 Compounds of the formula I in which X is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl can advantageously be obtained by the following synthesis route:



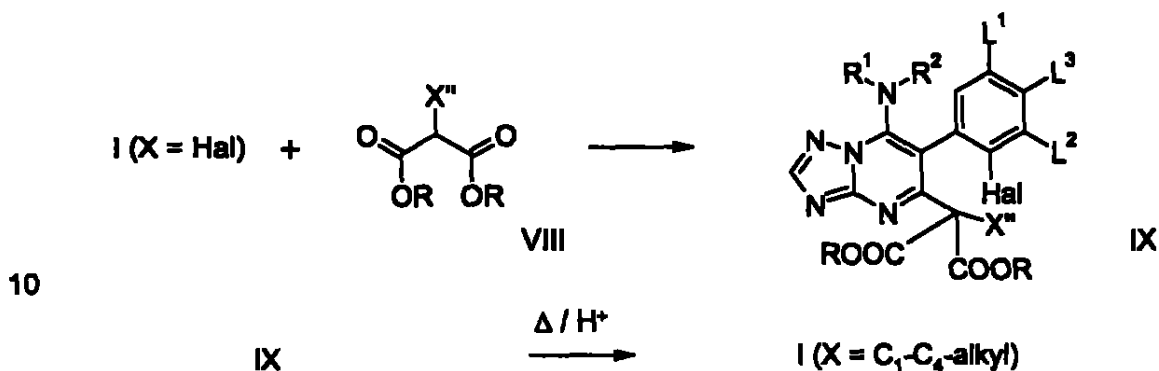
- 15 Starting with the ketoesters IIIa, the 5-alkyl-7-hydroxy-8-phenyltriazolopyrimidines IVa are obtained. In the formulae IIIa and IVa, X' is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl. If the easily obtainable 2-phenylacetoacetates (IIIa where X' = CH₃) are used, 5-methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines 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.

- 20 The resulting 5-alkyl-7-hydroxy-8-phenyltriazolopyrimidines are reacted with halogenating agents [HAL] under the conditions described further above to give the 7-halotriazolopyrimidines of the formula Va in which Y is a halogen atom. Preference is given to using chlorinating or brominating agents, such as phosphorus oxybromide, phosphorus oxychloride, thionyl chloride, thionyl bromide or sulfur chloride.
- 25 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.

- 5 Alternatively, compounds of the formula I in which X is C₁-C₄-alkyl can also be prepared from compounds I in which X is halogen, in particular chlorine, and malonates of the formula VIII. In the formula VIII, Xⁿ is hydrogen or C₁-C₃-alkyl and R is C₁-C₄-alkyl. They are converted into compounds of the formula IX and decarboxylated to give the compounds I [cf. US 5,994,360].



- 15 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.

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

- 25 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.

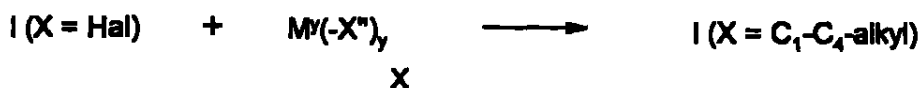
- 30 Suitable acids are hydrochloric acid, sulfuric acid, phosphoric acid, formic acid, acetic acid, p-toluenesulfonic acid. Suitable solvents are water, aliphatic hydrocarbons, such as pentane, hexane, cyclohexane and petroleum ether, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, halogenated 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.

5

Compounds of the formula I in which X is C₁-C₄-alkyl can also be prepared 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.

10



15

In formula X, M is a metal ion of valency y, such as, for example, B, Zn or Sn, and X'' is C₁-C₃-alkyl. This reaction can be carried out, for example, analogously to the following methods: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1994), 1187, *ibid.* 1 (1998) 2345; WO-A 99/41255; Aust. J. Chem. 43 (1990), 733; J. Org. Chem. 43 (1978), 358; J. Chem. Soc. Chem. Commun. (1979), 886; Tetrahedron Lett. 34 (1983), 8267; *ibid.* 33 (1992), 413.

20

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.

25

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.

30

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 plants, or in the harmful fungus to be controlled.

35

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;

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_2 -haloalkyl, such as chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, pentafluoroethyl or 1,1,1-trifluoroprop-2-yl;

alkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 4, 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-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;

- 5 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;

- 10 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, 15 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;

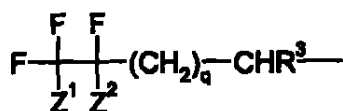
- 20 cycloalkyl: mono- or bicyclic saturated hydrocarbon groups having 3 to 6 or 8 carbon ring members, for example C_3-C_8 -cycloalkyl such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl and cyclooctyl;

- 25 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:

- 5- or 6-membered heterocyclidyl 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
30 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,
35 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;

- 40 - 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,
- 5 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
- 10 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 CH₂ groups, for example CH₂, CH₂CH₂,
- 15 CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ and CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;
- oxyalkylene: divalent unbranched chains of 2 to 4 CH₂ groups, where one valency is attached to the skeleton via an oxygen atom, for example OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ and OCH₂CH₂CH₂CH₂;
- 20 oxyalkyleneoxy: divalent unbranched chains of 1 to 3 CH₂ groups, where both valencies are attached to the skeleton via an oxygen atom, for example OCH₂O, OCH₂CH₂O and OCH₂CH₂CH₂O.
- 25 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 R³ of formula I.
- 30 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:
- 35 Preference is given to compounds of the formula I in which R¹ is not hydrogen.
- Particular preference is given to compounds I in which R¹ is C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl or C₁-C₆-haloalkyl.
- 40 Preference is given to compounds I in which R¹ is a group A:



A

in which

- 5
 Z^1 is hydrogen, fluorine or $\text{C}_1\text{--C}_6$ -fluoroalkyl,
 Z^2 is hydrogen or fluorine, or
 Z^1 and Z^2 together form a double bond;
 q is 0 or 1; and
 10 R^3 is hydrogen or methyl.

Moreover, preference is given to compounds I in which R^1 is $\text{C}_3\text{--C}_6$ -cycloalkyl which may be substituted by $\text{C}_1\text{--C}_4$ -alkyl.

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

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

- 20 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.

- 25 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 piperidinyl, morpholinyl or thiomorpholinyl ring, in particular a piperidinyl ring which, if appropriate, is substituted by one to three groups halogen, $\text{C}_1\text{--C}_4$ -alkyl or $\text{C}_1\text{--C}_4$ -haloalkyl. Particular 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.

- 30 The invention furthermore preferably provides compounds I in which R^1 and R^2 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, $\text{C}_1\text{--C}_4$ -alkyl or $\text{C}_1\text{--C}_4$ -haloalkyl, in particular by 3,5-dimethyl or 3,5-di(trifluoromethyl).

- 35 In addition, particular preference is also given to compounds of the formula I in which R^1 is $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{--CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{--CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{--C}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{--CF}_3$, $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, cyclopentyl or cyclohexyl; R^2 is hydrogen or methyl; or

13

R¹ and R² together are -(CH₂)₂CH(CH₃)(CH₂)₂-, -(CH₂)₂CH(CF₃)(CH₂)₂- or -(CH₂)₂O(CH₂)₂-.

- 5 Preference is given to compounds I in which X is halogen, C₁-C₄-alkyl, cyano or C₁-C₄-alkoxy, such as chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy, especially chlorine or methyl, in particular chlorine.

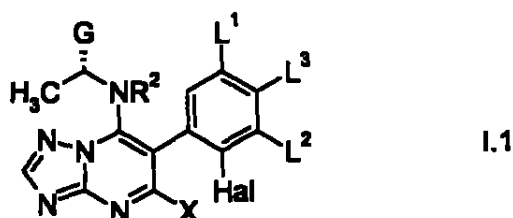
In formula I, Hal is in particular chlorine or fluorine.

- 10 Preference is furthermore given to compounds I in which L¹ is C₁-C₂-alkoxy, such as methoxy; cyano; halomethyl, such as trifluoromethyl or C₁-C₄-alkoxycarbonyl, such as methoxycarbonyl. In these compounds, L² and L³ are particularly preferably hydrogen.

- 15 Preference is likewise given to compounds I in which L² is C₁-C₂-alkoxy, such as methoxy; cyano; halomethyl, such as trifluoromethyl or C₁-C₄-alkoxycarbonyl, such as methoxycarbonyl. In these compounds, L¹ and L³ are particularly preferably hydrogen.

In addition, preference is given to compounds I in which L³ is hydrogen.

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



in which

- 25 G is C₂-C₆-alkyl, in particular ethyl, n- and isopropyl, n-, sec-, tert-butyl, and C₁-C₄-alkoxymethyl, in particular ethoxymethyl, or C₃-C₆-cycloalkyl, in particular cyclopentyl or cyclohexyl;

R² is hydrogen or methyl; and

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

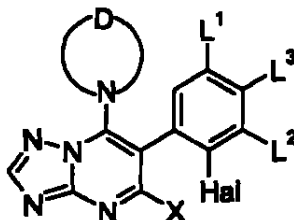
30

A further preferred embodiment of the invention relates to compounds in which R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are attached 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/or may carry

- 35 one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-halo-

14

alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₃-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, C₁-C₆-alkylene and oxy-C₁-C₆-alkyleneoxy. These compounds correspond in particular to the formula I.2



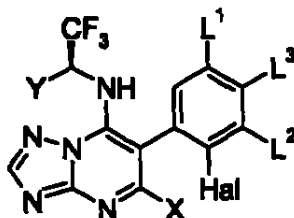
I.2

5

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, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy and C₁-C₂-haloalkyl; and
- X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy.

- 15 A further preferred embodiment of the invention relates to compounds of the formula I.3



I.3

- 20 in which Y is hydrogen or C₁-C₄-alkyl, in particular methyl and ethyl, and X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy.

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.

- Table 1
- Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 2

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 3

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 4

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 5

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 6

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 7

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 8

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 9

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 10

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 11

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 12

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 13

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 14

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 15

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 16

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 17

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 18

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 19

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 20

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 21

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 22

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 23

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 24

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 25

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 26

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 27

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 28

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is trifluoromethyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 29

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 30

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 31

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 32

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxycarbonyl, L² and L³ are hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 33

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

47

Table 34

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 35

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 36

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 37

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 38

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 39

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 40

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 41

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

48
48

Table 42

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 43

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 44

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 45

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 46

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 47

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 48

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 49

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 50

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 51

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 52

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxy, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 53

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 54

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 55

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 56

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is cyano, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 57

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 58

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 59

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 60

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is trifluoromethyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 61

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 62

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 63

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 64

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is hydrogen, L² is methoxycarbonyl, L³ is hydrogen and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 65

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

51

- Table 66
Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 5
- Table 67
Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 10
- Table 68
Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 15
- Table 69
Compounds of the formula I in which X is chloro, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 20
- Table 70
Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 25
- Table 71
Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 30
- Table 72
Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 35
- Table 73
Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A
- 40

Table 74

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 75

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 76

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 77

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 78

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 79

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 80

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 81

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 82

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 83

Compounds of the formula I in which X is methy, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 84

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 85

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 86

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 87

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 88

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 89

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 90

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 91

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 92

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 93

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 94

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 95

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 96

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 97

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 98

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 99

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 100

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 101

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 102

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 103

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 104

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ and L² are hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 105

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 106

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 107

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 108

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 109

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 110

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 111

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 112

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 113

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 114

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 115

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 116

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 117

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 118

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 119

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 120

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 121

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 122

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 123

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 124

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 125

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 126

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 127

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 128

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 129

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 130

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 131

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 132

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 133

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 134

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 135

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 136

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 137

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 138

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 139

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 140

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 141

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 142

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 143

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 144

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is cyano, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 145

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 146

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 147

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 148

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 149

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 150

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 151

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 152

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 153

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 154

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 155

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 156

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 157

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 158

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 159

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 160

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 161

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 162

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 163

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 164

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is fluorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 165

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 166

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 167

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 168

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is fluorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 169

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 170

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 171

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 172

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is chlorine and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 173

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 174

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 175

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 176

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is cyano and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table 177

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

40

Table 178

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

5

Table 179

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

10

Table 180

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxy and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

15

Table 181

Compounds of the formula I in which X is chlorine, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

20

Table 182

Compounds of the formula I in which X is cyano, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

25

Table 183

Compounds of the formula I in which X is methyl, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

30

Table 184

Compounds of the formula I in which X is methoxy, Hal is chlorine, L¹ is methoxy, L² is hydrogen, L³ is methoxycarbonyl and the combination of R¹ and R² corresponds for each compound to one row of Table A

35

Table A

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

No.	R ¹	R ²
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-45	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-48	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-54	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-57	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-63	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-66	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-72	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H

No.	R ¹	R ²
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-75	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-77	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-78	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-80	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-81	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-82	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-83	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-84	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-85	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-86	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-87	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-88	CH ₂ -C≡CH	H
A-89	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-90	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-91	cyclopentyl	H
A-92	cyclopentyl	CH ₃
A-93	cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-94	cyclohexyl	H
A-95	cyclohexyl	CH ₃
A-96	cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-97	CH ₂ -C ₆ H ₅	H
A-98	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃
A-99	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-100	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-101	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-102	-CH(CH ₃)CH ₂ -CH=CHCH ₂ -	
A-103	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-104	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-105	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-106	-CH ₂ CHF(CH ₂) ₃ -	
A-107	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-108	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-109	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-110	-(CH ₂) ₅ -	

No.	R ¹	R ²
A-111	-(CH ₂) ₄ -	
A-112	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-113	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-114	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-115	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-116	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-117	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	
A-118	-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-119	-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-120	-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -	
A-121	-(CH ₂) ₆ -	
A-122	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -	
A-123	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-124	-N=CH-CH=CH-	
A-125	-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-	
A-126	-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-	

5 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.

10 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.

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

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

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

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 35 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:

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

Suitable surfactants are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutynaphthalenesulfonic 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.

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
5 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
10 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
15 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
20 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
25 cyclohexanone with addition of a dispersant, for example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion.

C Emulsifiable concentrates (EC)

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

D Emulsions (EW, EO)

40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene
35 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.

40 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.

5

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.

10

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

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.

15

2. Products to be applied undiluted

20 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.

25

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.

30

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 purposes; the intention is to ensure in each case the finest possible distribution of the active compounds according to the invention.

35

40

7A

Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions, 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.

- 5 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.

- 10 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%.

- 15 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.

- 20 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.

- 25 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 fungicides results in many cases in an expansion of the fungicidal spectrum of activity being obtained.

- 30 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 not limit them:

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,
- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph,
- 35 fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamine or tridemorph,
- anilinopyrimidines, such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyprodinyl,
- antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,
- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole,
- 40 dinitroconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole,

flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizole or triticonazole,

- dicarboximides, such as Iprodione, myclozolin, procymidone or vinclozolin,
- 5 • dithiocarbamates, such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram or zineb,
- heterocyclic compounds, such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithlanon, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol,
- 10 • probenazole, proquinazid, pyrifenoxy, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole or triforine,
- copper fungicides, such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride or basic copper sulfate,
- nitrophenyl derivatives, such as binapacryl, dinocap, dinobuton or nitrophthal-isopropyl,
- 15 • phenylpyrroles, such as fenpiclonil or fludioxonil,
- sulfur,
- other fungicides, such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, diclomezine, diclocymet,
- 20 • dithiofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenone, pencycuron, propamocarb, phthalide, toldofos-methyl, quintozone or zoxamide,
- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl,
- 25 • metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- sulfenic acid derivatives, such as captan, dichlofluanid, folpet or tolyfluanid,
- cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

30

Synthesis examples

With appropriate modification of the starting materials, the procedures given in the synthesis examples below were used to obtain further compounds I. The compounds

35 obtained in this manner are listed in the table that follows, together with physical data.

Example 1: Preparation of 5-chloro-6-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)-7-(4-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

a) Dimethyl 2-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)malonate

5

A mixture of 5.1 g (0.03 mol) of potassium dimethylmalonate and 1 g of copper bromide in 40 ml of diethylene glycol dimethyl ether was stirred at 100° for about 1 hour. 2.43 g (0.01 mol) of 2-fluoro-3-trifluorophenylbromobenzene were then added, and the mixture was stirred at 100°C for about another 3 hours. After addition of a further 3 g of potassium dimethylmalonate, stirring was continued at 110°C for 3 hours.

10

The reaction mixture was then acidified with conc. hydrochloric acid and extracted with methyl t-butyl ether (MTBE). The combined organic phases were dried and freed from the solvent. The residue obtained was taken up in cyclohexane/ethyl acetate mixtures and filtered off through silica gel. The eluate was freed from the solvent, the residue was dried. 2.7 g of the title compound were obtained as residue.

15

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 7.75 (t, 1H); 7.6 (t, 1H); 7.3 (t, 1H); 5.1 (s, 1H); 3.8 (s, 6H).

20

b) 5,7-Dihydroxy-6-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

A solution of 2.7 g (9.2 mmol) of dimethyl 2-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)malonate (from ex. 1a) and 0.8 g (9.5 mmol) of aminotriazole in 2.1 g of tributylamine was stirred at about 170°C for about 3 hours, with distillative removal of methanol. The reaction mixture was then cooled to about 80-100°C, and 20% strength aqueous sodium hydroxide solution was added. The aqueous phase was extracted with MTBE and acidified with conc. hydrochloric acid. The aqueous phase was extracted with methylene chloride, the aqueous phase was filtered off, the filter residue was dissolved in tetrahydrofuran. The combined organic phases were both dried and freed from the solvents. This gave as residue 2.0 g of the title compound as a beige solid which was used for the next reaction without further purification.

25

30

c) 5,7-Dichloro-6-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

A solution of 2.0 g (6.7 mmol) of 5,7-dihydroxy-6-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine (from example 1b) in 30 ml of phosphorus oxychloride was stirred at 100°C for about 5 hours. The excess phosphorus oxychloride was then distilled off, the residue was taken up in methylene chloride and water and this mixture was neutralized using NaHCO₃. The phases were then separated and the aqueous phase was extracted with methylene chloride. The combined organic phases were then

35

40

dried and the solvent was distilled off. Chromatography on silica gel using cyclohexane/ethyl acetate mixtures gave 0.9 g of the title compound.

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8.65 (s, 1H); 8.4 (t, 1H); 7.6 (t, 1H); 7.5 (t, 1H).

5

1d) 5-Chloro-6-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

- 10 A solution of 0.25 g (0.7 mmol) of 5,7-dichloro-6-(2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine (from example 1c), 0.106 g (146 µl, 1.05 mmol) of trimethylamine and 0.104 g of 4-methylpiperidine (as a 0.8 M solution in methylene chloride) in 4 ml of methylene chloride was stirred at 35°C for 5 hours and at 20-25°C for 15 hours. The reaction mixture was extracted with dil. hydrochloric acid and brine. The organic phase was dried and freed from the solvent. 0.156 g of the title compound
- 15 remained as a pale crystal material of m.p. 166-170°C.

HPLC/MS: R_t=3.929 min; m/z=414 (M⁺+H)

- 20 HPLC column: RP-18 column (Chromolith Speed ROD from Merck KgaA, Germany)
Mobile phase: acetonitrile + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA)/water + 0.1% TFA (gradient from 5:95 to 95:5 over 5 min), 40°C.
MS: quadrupole electrospray ionization, 80 V (positive mode)

Table I - Compounds of the formula I

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-1	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	CF ₃	H	H	166-170
I-2	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	CF ₃	H	139-143
I-3	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	144-147
I-4	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	135-137
I-5	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	100-130
I-6	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	oil
I-7	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	CF ₃	H	110-115
I-8	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	CF ₃	H	H	163-168
I-9	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	CF ₃	H	H	159-161
I-10	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	CF ₃	H	107-113
I-11	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	159
I-12	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	oil
I-13	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	73-94
I-14	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	70-92
I-15	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	77-115
I-16	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	171-177
I-17	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	66-105
I-18	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	66-105
I-19	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	135-147
I-20	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	162-169

8

24

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-21	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	121-126
I-22	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	166-170
I-23	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	135-165
I-24	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	158-165
I-25	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	99-105
I-26	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	OCH ₃	H	102-108
I-27	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	147-151
I-28	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	oil
I-29	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	174-179
I-30	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	oil
I-31	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	133-137
I-32	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	oil
I-33	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	146-149
I-34	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	oil
I-35	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	oil
I-36	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	170-175
I-37	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	oil
I-38	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	oil
I-39	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	-CN	H	H	213
I-40	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	CN	H	157
I-41	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	186-187

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-42	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	H	OCH ₃	H	133-135
I-43	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	CF ₃	H	H	155-157
I-44	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	H	CF ₃	H	196-197
I-45	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	175-183
I-46	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	150-154
I-47	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	175-177
I-48	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	112-120
I-49	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	150-160
I-50	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	oil
I-51	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	276-279
I-52	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	170-182
I-53	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	144-148
I-54	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	146-153
I-55	(S)-CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	250-253
I-56	(R)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	72-78
I-57	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	87-102
I-58	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	89-106
I-59	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	213-217
I-60	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	179-182
I-61	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	184-186
I-62	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	86-94

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-63	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	127-143
I-64	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	oil
I-65	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	141-146
I-66	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	oil
I-67	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	196-200
I-68	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	97-100
I-69	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	256-260
I-70	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	222-228
I-71	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	oil
I-72	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	oil
I-73	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	112-114
I-74	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	CN	192
I-75	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	oil
I-76	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	oil
I-77	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	oil
I-78	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	oil
I-79	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	99
I-80	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CN	H	CN	195-202
I-81	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	105-112
I-82	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	196-201
I-83	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	112

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-84	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	CN	CN	oil
I-85	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	168-174
I-86	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	CN	CN	oil
I-87	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	128-129
I-88	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	159-162
I-89	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-CN	H	CN	oil
I-90	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	145-146
I-91	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	-CN	H	CN	243-245
I-92	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	-CN	H	CN	243-247
I-93	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	-CN	H	CN	154-157
I-94	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	129-131
I-95	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-CN	H	CN	oil
I-96	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	-OCH ₃	H	OCH ₃	214-216
I-97	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	-OCH ₃	H	Cl	177-178
I-98	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	182-184
I-99	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	168-170
I-100	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	182-184
I-101	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	oil
I-102	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	176-178
I-103	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	175-177
I-104	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	210-216

24

25

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-105	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	188-189
I-106	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	118-121
I-107	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	190-193
I-108	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	oil
I-109	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	210-212
I-110	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	193-195
I-111	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	oil
I-112	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	oil
I-113	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	193
I-114	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	CN	oil
I-115	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	203-204
I-116	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	153-154
I-117	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	165-168
I-118	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-119	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-120	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	214-216
I-121	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	oil
I-122	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	oil
I-123	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-124	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	156-157
I-125	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	139

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-126	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	168-169
I-127	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	179-180
I-128	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	142-143
I-129	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-130	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-131	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	oil
I-132	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	247-248
I-133	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	215-217
I-134	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	205-207
I-135	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	204-206
I-136	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	225-228
I-137	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	204-206
I-138	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	128-128
I-139	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	oil
I-140	(R)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	176-177
I-141	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-142	(R)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-143	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-144	(R)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	173-174
I-145	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-146	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	oil

85

86

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-147	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	oil
I-148	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-149	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-150	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	oil
I-151	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-152	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-153	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	oil
I-154	(S)-CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	oil
I-155	(S)-CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	oil
I-156	(S)-CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	249-250
I-157	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	oil
I-158	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil
I-159	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil
I-160	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil
I-161	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil
I-162	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	oil
I-163	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	oil
I-164	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	oil
I-165	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil
I-166	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil
I-167	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	oil

85

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-168	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	136-138
I-169	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	175-176
I-170	-(CH ₂) _x -CH(CH ₃)-(CH ₂) _x		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	171-176
I-171	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	120-153
I-172	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	58-78
I-173	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	138-144
I-174	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	180-189
I-175	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	170-176
I-176	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	oil
I-177	-CH(CH ₃)-(CH ₂) _x		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	163-188
I-178	-CH(CH ₃)-(CH ₂) _x		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	145-165
I-179	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	116-123
I-180	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	60-98
I-181	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	oil
I-182	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) _x		Cl	F	H	CF ₃	H	oil
I-183	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-184	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	72-78
I-185	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-186	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-187	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-188	-(CH ₂) _x -CH(CH ₃)-(CH ₂) _x		Cl	F	H	CF ₃	H	222-227

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-189	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-190	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-191	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	oil
I-192	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	oil
I-193	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	74-143
I-194	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	oil
I-195	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	oil
I-196	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	oil
I-197	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	169-171
I-198	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	148-153
I-199	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	88-90
I-200	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	160-182
I-201	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₆ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	175-177
I-202	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	84-89
I-203	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	oil
I-204	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	oil
I-205	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	oil
I-206	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	147-150
I-207	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	H	188-189
I-208	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CN	H	H	124-125
I-209	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	199-200

88

89

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Phys. data (¹ H NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); m.p. [°C])
I-210	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	CN	H	H	152-153
I-211	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	oil
I-212	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -		Cl	Cl	H	CN	H	204
I-213	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	CN	H	189-190
I-214	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	H	oil
I-215	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	oil
I-216	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	CN	H	H	oil
I-217	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	oil
I-218	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	oil
I-219	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	CN	H	H	oil
I-220	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	oil

Examples for the action against harmful fungi

The fungicidal action of the compounds of the formula I was demonstrated by the following tests.

5

The active compounds were prepared separately as a stock solution with 25 mg of active compound which was made up to 10 ml using a mixture of acetone and/or DMSO and the emulsifier Uniperol® EL (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkylphenols) in a volume ratio of solvent/emulsifier of 99 to 1. The mixture was then made up with water to 100 ml. This stock solution was diluted with the solvent/emulsifier/water mixture described to the concentration of active compound stated below.

10

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

15

Bell-pepper seedlings of the cultivar "Neusiedler Ideal Elite" were, after 2-3 leaves were well developed, sprayed to runoff point with an aqueous suspension having the concentration of active compound stated below. The next day, the treated plants were inoculated with a spore suspension of *Botrytis cinerea* which contained 1.7×10^8 spores/ml in a 2% strength aqueous biomalt solution. The 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 %.

20

25

In this test, the plants which had been treated with 63 ppm of the active compounds I-3, I-4, I-7, I-13 to I-16, I-18 to I-22, I-24 to I-26, I-28, I-30 to I-32, I-34, I-38, I-40, I-42, I-45, I-47 to I-49, I-52, I-54 to I-57, I-88, I-99, I-106, I-114, I-116, I-121, I-136, I-137, I-140, I-144, I-149, I-159, I-167, I-172, I-174, I-176, I-179, I-180, I-182 to I-185, I-190, I-191, I-193, I-199, I-202, I-207 to I-209 or I-215 showed an infection of not more than 30%, whereas the untreated plants were 85% infected.

30

Use example 2: Activity against early blight of tomato caused by *Alternaria solani*

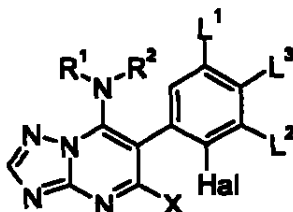
Leaves of potted plants of the cultivar "Goldene Königin" were sprayed to runoff point with an aqueous suspension having the concentration of active compound stated below. The next day, the leaves were infected with an aqueous spore suspension of *Alternaria solani* in a 2% biomalt solution having a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

35

40

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5

in which the substituents are as defined below:

- 10 **R¹, R²** Independently of one another are C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₃-C₈-halocycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-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

- R¹ and R²** 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/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-haloalkoxy, C₃-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-haloalkenyloxy, C₁-C₈-alkylene and oxy-C₁-C₃-alkyleneoxy;

20

- 25 **R¹ and/or R²** may carry one to four identical or different groups R^a:

- R^a** is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-haloalkoxy, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-alkylthio, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-haloalkenyloxy, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-alkynyloxy, C₃-C₈-haloalkynyloxy, C₃-C₈-cycloalkoxy, C₃-C₈-cycloalkenyloxy, C₁-C₃-oxyalkyleneoxy, 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 :

5 R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy, alkoxy carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothio-
10 carbonyl, 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;

15 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
20 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;

25 Hal is halogen;

L^1 , L^2 are hydrogen, cyano, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_3-C_6 -alkenyloxy or $C(=O)A$, where at least one group L^1 or L^2 is not hydrogen;

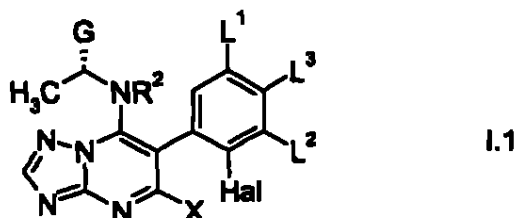
30 A is hydrogen, hydroxy, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_1-C_6 -haloalkoxy, C_1-C_6 -alkylamino or di- $(C_1-C_6$ -alkyl)amino;

L^3 is hydrogen, halogen, cyano, nitro, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_1-C_6 -alkoxycarbonyl;

35 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.1

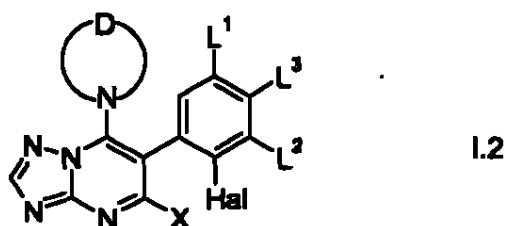


- 5 in which

G is C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkoxymethyl or C₃-C₆-cycloalkyl;
R² is hydrogen or methyl; and
X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy and
L¹ to L³ and Hal are as defined in claim 1.

10

4. A compound of the formula I.2



- 15 in which

D together with the nitrogen atom forms 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 may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy and C₁-C₂-haloalkyl;

20

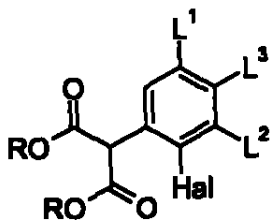
X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy and
L¹ to L³ and Hal are as defined in claim 1.

5. A process for preparing the compounds of the formula I as claimed in claim 1 in which X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy, by reacting 5-amino-1,2,4-triazole of the formula II

25

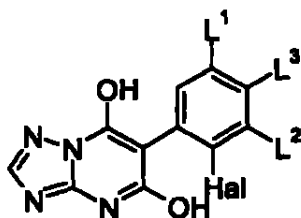


- 30 with phenylmalonates of the formula III,



III

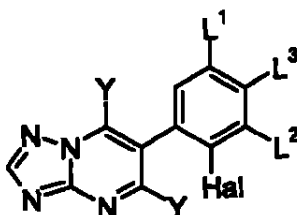
in which R is alkyl, to give dihydroxytriazolopyrimidines of the formula IV,



IV

5

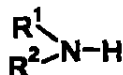
halogenation to give the dihalo compounds of the formula V,



V

10

In which Y is halogen and reaction of V with amines of the formula VI



VI

15

to give compounds of the formula I in which X is halogen, if desired, to prepare compounds of the formula I in which X is cyano, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy, reaction of compounds I in which X is halogen with compounds of the formula VII

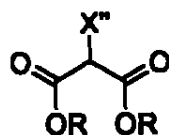
20



VII

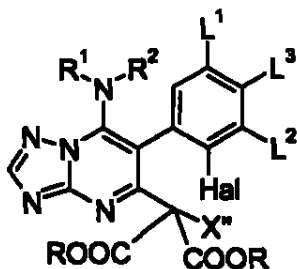
25

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 compounds of the formula I in which X is halogen with malonates of the formula VIII



VIII

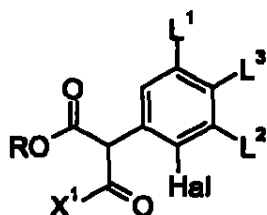
5 in which X⁺ is hydrogen or C₁-C₃-alkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give compounds of the formula IX



IX

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

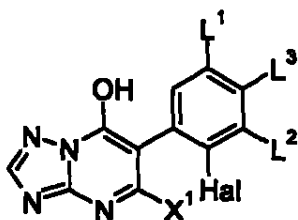
6. A process for preparing the compounds of the formula I as claimed in claim 1 in which X is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl by reacting 5-amino-1,2,4-triazole of the formula II as set forth in claim 5 with keto esters of the formula IIIa



IIIa

15

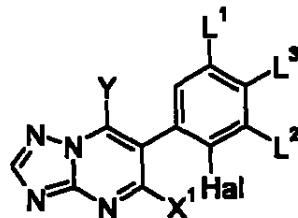
in which X¹ is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give 5-alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines of the formula IVa,



IVa

20

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



Va

in which Y is halogen and reaction of Va with amines of the formula VI as set forth in claim 5 to give compounds I in which X is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl.

5

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

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

10

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

15

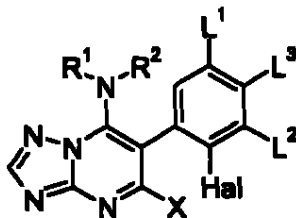
10. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or seeds to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I as claimed in claim 1.

6-(2-Halophenyl)triazolopyrimidines, their preparation and their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising these compounds

Abstract

5

Triazolopyrimidines of the formula I



10 in which the substituents are as defined below:

R^1 , R^2 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^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 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^1 , L^2 are hydrogen, cyano, haloalkyl, alkoxy, alkenyloxy or $C(=O)A$, where at least one group L^1 or L^2 is not hydrogen;

25

A is hydrogen, hydroxyl, alkyl, alkoxy, haloalkoxy, C_1-C_6 -alkylamino or dialkylamino;

L^3 is hydrogen, halogen, cyano, nitro, haloalkyl, alkoxy or alkoxycarbonyl;

30

X is halogen, cyano, alkyl, haloalkyl, alkoxy or haloalkoxy;

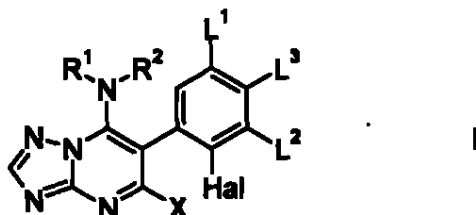
processes and intermediates for preparing these compounds, compositions comprising them and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

6-(2-Halógenofenil)-triazolopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

Descripción

5

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



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 R¹, R² significan, independientemente, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, halógenocicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₈, halógenoalquenilo C₂-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, halógenocicloalquenilo C₃-C₈, alquinilo C₂-C₈, halógenoalquinilo C₂-C₈ o fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S,
- 15

- R¹ y R² también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está ligado por medio de N y pueden contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o contener uno o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo, C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈,
- 20

halógenoalquenilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆,
halógenoalqueniloxi C₃-C₆, alquileo C₁-C₆ y oxi-alquileo C₁-C₃;

R¹ y/o R² pueden llevar uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes:

5

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, alquilo C₁-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆,
alquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-
C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, di -alquilamino
C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, halógenoalquenilo C₂-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆,

10

alqueniloxi C₂-C₆, halógenoalqueniloxi C₃-C₆, alquinilo C₂-C₆,
halógenoalquinilo C₂-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, halógenoalquiniloxi C₃-C₆,
cicloalcoxi C₃-C₆, C₃-cicloalquenoxi C₆, oxialquileo C₁-C₃, fenilo, naftilo,
heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o diez
miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S,

15

pudiendo estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos por su parte estar
parcial o completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^b:

20

R^b es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, mercapto, amino, carboxilo,
aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo,
alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino,
dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo,
alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo,
dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo,

25

dialquilaminotiocarbonilo, conteniendo los grupos alquilo en estos

radicales 1 a 6 átomos de carbono y los grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales 2 a 8 átomos de carbono;

y/o uno a tres de los radicales siguientes:

5

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterocicliloxi, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros anulares; arilo, ariloxi, ariltio, aril-alcoxi C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆, hetarilo, hetarlloxi, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetarilo 5 ó 6 miembros anulares, pudiendo los sistemas cíclicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo;

10

Hal es halógeno;

15

L¹, L² significan hidrógeno, ciano, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆ o C(=O)A, siendo preciso que por lo menos un grupo L¹ o L² no es hidrógeno;

A es hidrógeno, hidroxí alquilo, C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆ o di-(C₁-C₆-alquil)amino;

20

L³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆;

X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₂.

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

De la EP-A 71 792, EP-A 550 113 se conocen, generalmente, 5-cloro-6-fenil-7-amino-
triazolopirimidinas. En la WO 03/080615 se proponen en términos generales 6-fenil-
10 triazolopirimidinas, cuyo grupo fenilo puede llevar un grupo alquilamida en la posición para. Estos compuestos son conocidos para combatir hongos nocivos.

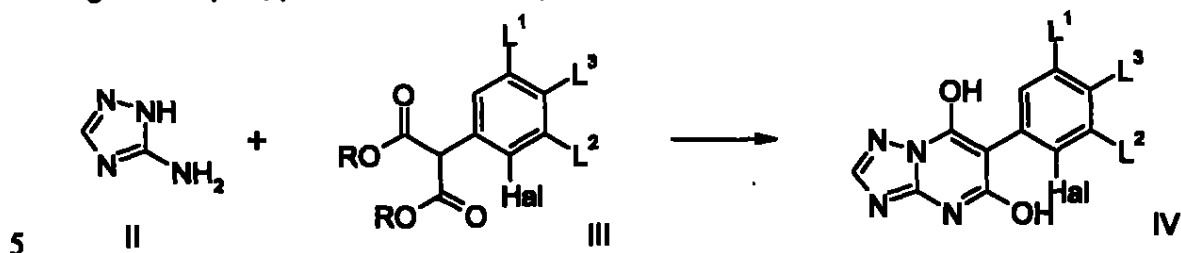
Los compuestos según la invención se distinguen de los compuestos descritos en la
WO 03/080615 por la posición del grupo alquilamida como sustituyente del anilo 6-
15 fenilo.

Pero su efecto no siempre es satisfactorio en todos los sentidos. Partiendo de ello, la
presente invención tiene por objeto proveer compuestos con efecto mejorado y/o
espectro de acción más amplio.

20

Por tanto, se encontraron los compuestos definidos al comienzo. Además, se
encontraron procedimientos para su obtención, productos que los contienen, así como
procedimientos para controlar hongos nocivos usando estos compuestos I.

Los compuestos según la invención pueden ser preparados, valiéndose de diferentes métodos. Ventajosamente se preparan, partiendo de 5-aminotriazol de la fórmula II con malonatos de fenilo correspondientemente sustituidos de la fórmula III, donde R significa alquilo, preferentemente, alquilo C₁-C₆, especialmente, metilo o etilo.



La reacción suele ser realizada a temperatura de 80°C a 250°C, preferentemente, 120°C a 180°C, sin disolvente o en un disolvente orgánico inerte, en presencia de una base [ver EP-A 770 615] o en presencia de ácido acético bajo las condiciones conocidas de Adv. Het. Chem. Vol. 57, p. 81 y sig. (1993).

10

Disolventes apropiados son los hidrocarburos alifáticos, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, o, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados, éteres, nitrilos, cetonas, alcoholes, así como N-metilpirrolidona, sulfóxido de dimetilo dimetilformamida y dimetilacetamida. Muy preferentemente, se realiza la reacción sin disolvente o en

15 clorobenceno, xileno, sulfóxido de dimetilo, n-metilpirrolidona. También se pueden usar mezclas de los disolventes mencionados.

Como bases son apropiados, generalmente, los compuestos inorgánicos, tales como hidróxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, óxidos de metal alcalino y alcalinotérreo,

20 hidruros de metal alcalino y alcalinotérreo, amidas de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, así como hidrogenocarbonatos de metal alcalino , compuestos de metal orgánicos, especialmente, alquilos de metal alcalino, haluros de

alquilmagnesio, así como alcoholatos de metal alcalino y alcalinotérreo y dimetoximagnesio, además, bases orgánicas, p.ej. aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tri-isopropilamina, tributilamina y N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, piridina, piridinas sustituidas, tales como colidina, lutidina y 4-dimetil-aminopiridina, así como aminas bicyclicas. Se prefieren, especialmente, las aminas terciarias, tales como tri-isopropilamina, tributilamina, N-metilmorfolina o N-metilpiperidina.

Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también es posible usarlas en cantidad equimolar, en exceso, o, en caso dado, como disolvente.

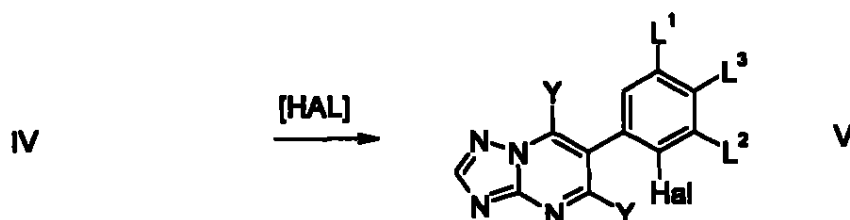
Los eductos suelen ser reaccionados entre si en cantidades equimolares. Pero para el rendimiento puede ser ventajoso usar las base y el malonato III en exceso con respecto al triazol.

15

Malonatos de fenilo de la fórmula III se preparan, ventajosamente, haciendo reaccionar bromobencenos correspondientemente sustituidos con malonatos de dialquilo bajo catálisis de Cu(I) [ver Chemistry Letters, p. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

20 Las dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV son transformadas pabajo las condiciones conocidas de la WO-A 94/20501 en las dihalógenopirimidinas de la fórmula V, en la que Y significa un átomo de halógeno, preferentemente un átomo de bromo o de cloro, especialmente, un átomo de cloro. Como agente de halogenación [HAL] se usan, preferentemente, un agente de cloración o de bromación, por ejemplo,

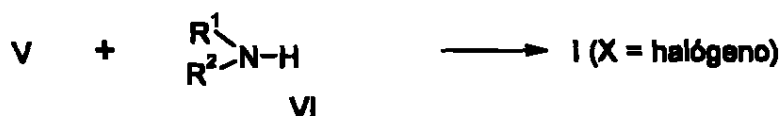
oxibromuro de fósforo o oxiclورو de fósforo, opcionalmente, en presencia de un disolvente.



Esta reacción se usa, generalmente, a 0°C hasta 150°C, preferentemente, a 80°C

5 hasta 125°C [ver EP-A 770 615].

Las dihalógenopirimidinas de la fórmula V se transforman ulteriormente con aminas de la fórmula VI,



10 donde R¹ y R² tienen las definiciones indicadas en la fórmula I, en compuestos de la fórmula I, donde X significa halógeno.

Esta reacción se realiza, ventajosamente, a 0°C hasta 70°C, preferentemente, a 10°C hasta 35°C, preferentemente, en presencia de un disolvente inerte, p.ej. un éter, tal

15 como dioxano, éter dietílico o, especialmente, tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados, p.ej. diclorometano y hidrocarburos aromáticos, p.ej. tolueno [ver WO-A 98/46608].

Es preferible usar una base, p.ej. una amina terciaria, tal como trietilamina o una base

20 inorgánica, o también amina excesiva de la fórmula VI puede servir de base.

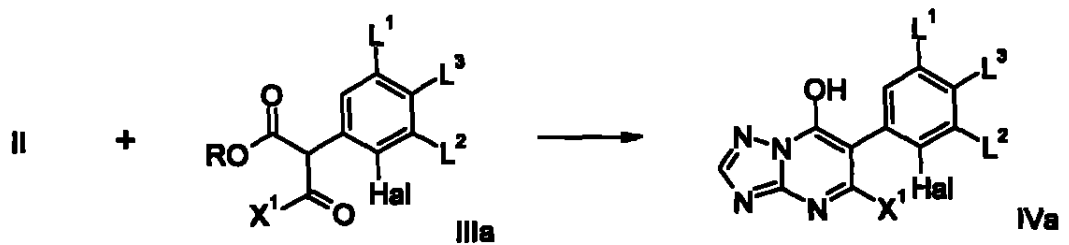
10A

- Compuestos de la fórmula I, donde X es ciano, alcoxi C₁-C₆ o halógenoalcoxi C₁-C₂, se pueden preparar, ventajosamente, haciendo reaccionar compuestos I, donde X significa halógeno, preferentemente, cloro, con compuestos M-X' (fórmula VII). Los compuestos VII representan, dependiendo el significado del grupo X' a incorporar, un
- 5 cianuro inorgánico, un alcoxilato o un halógenoalcoxilato. La reacción se efectúa, ventajosamente, en presencia de un disolvente inerte. El catión M en la fórmula VII tiene poca importancia, pero por razones prácticas se prefieren amonio, tetraquilamonio o sales de metal alcalino o alcalinotérreo.



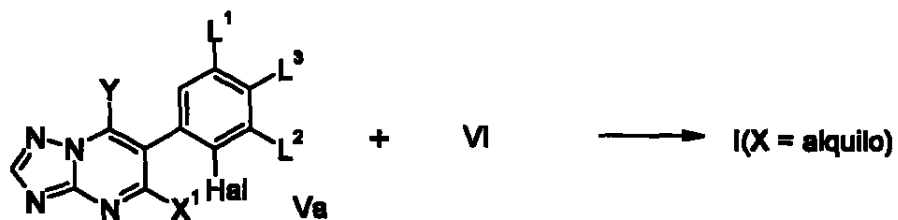
- La temperatura de reacción asciende, generalmente, a 0 hasta 120°C, preferentemente, a 10 hasta 40°C [ver J. Heterocycl. Chem., Vol.12, p. 861-863 (1975)].
- 15 Disolventes apropiados son: éteres, tales como dioxano, éter dietílico y, preferentemente tetrahidrofurano, alcoholes, tales como metanol o etanol hidrocarburos halogenados, como p.ej. diclorometano e hidrocarburos aromáticos, como p.ej. tolueno o acetonitrilo.
- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄ pueden ser preparados, ventajosamente, valiéndose del siguiente método de síntesis:

105



Partiendo de ceto ésteres IIIa werden se obtienen las 5-alkil-7-hidroxi-8-feniltriazolo-
 pirimidinas IVa. En las fórmulas IIIa y IVa representa X¹ alquilo C₁-C₄ o
 halógenoalquilo C₁-C₄. Usando los ésteres de ácido 2-fenilacético (IIIa con X¹=CH₃)
 5 fáciles de preparar se obtienen las 5-metil-7-hidroxi-8-feniltriazolopirimidinas, que son
 un objeto preferido de la presente invención [ver Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)].
 Los compuestos de partida IIIa se preparan, ventajosamente, bajo las condiciones
 descritas en la EP-A 10 02 788.

- 10 Las 5-alkil-7-hidroxi-8-feniltriazolopirimidinas así obtenidas se transforman con
 agentes de halogenación [HAL] bajo las condiciones arriba descritas en las 7-
 halógenotriazolopirimidinas de la fórmula Va, donde Y significa un átomo de halógeno.
 Preferentemente se usa un agente de cloración o de bromación, por ejemplo,
 oxibromuro de fósforo, oxícloruro de fósforo, cloruro de tionilo, bromuro de tionilo o
 15 cloruro de sulfurilo. La reacción se puede efectuar en ausencia o presencia de un
 disolvente. Temperaturas de reacción usuales son 0 a 150°C o preferentemente, 80 a
 125°C.

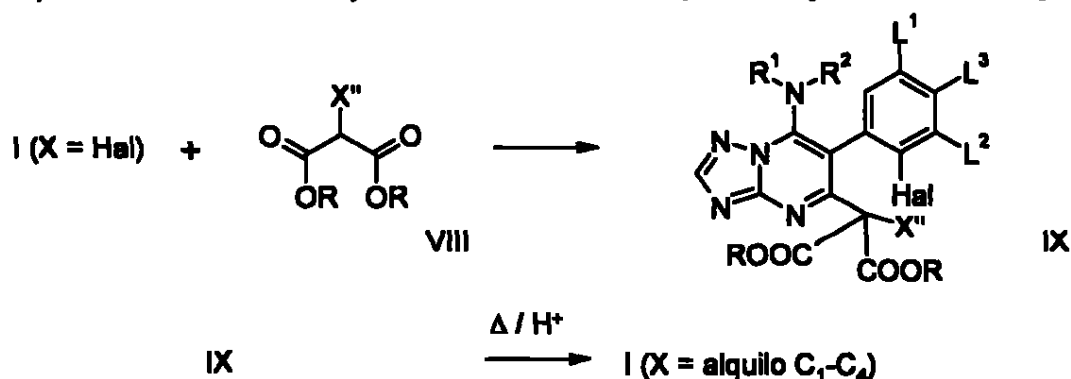


La reacción de Va con aminas VI se efectúa bajo las condiciones arriba descritas.

106

Los compuestos de la fórmula I, donde X significa alquilo C₁-C₄, pueden ser preparados, alternativamente, a partir de compuestos I, en los que X significa halógeno, especialmente, cloro, y malonatos de la fórmula VIII. En la fórmula VIII, X" significa hidrógeno o alquilo C₁-C₃ y R es alquilo C₁-C₄. Son transformados en

5 compuestos de la fórmula X y descarboxilados en compuestos I [ver US 5 994 360].



Los malonatos IX se conocen de la literatura [J. Am. Chem. Soc., Vol. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Vol. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Vol. 61, 1565 (1978)] o pueden

10 ser preparados según la literatura citada.

La saponificación subsiguiente del éster IX se efectúa bajo condiciones generalmente conocidas; en función de los diferentes elementos estructurales puede ser ventajosa una saponificación alcalina o ácida de los compuestos IX. Bajo las condiciones de la

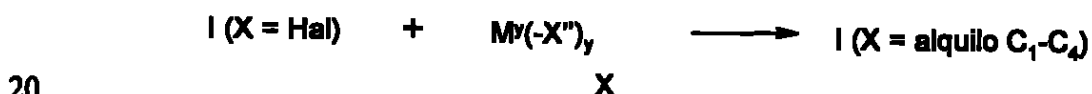
15 saponificación de éster ya puede efectuarse parcialmente o completamente la descarboxilación en I.

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

20 de un ácido.

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

Los compuestos de la fórmula I, en los que X significa alquilo C₁-C₄, también pueden ser preparados por acoplamiento de 5-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula I, donde X significa halógeno, con reactivos de metales orgánicos de la fórmula XI. En una forma de realización de este procedimiento se efectúa la reacción bajo catálisis de un metal transitorio, por ejemplo, catálisis de Ni o Pd.



En la fórmula X, M representa un ión de metal de la valencia Y, por ejemplo, B, Zn o Sn y X'' significa alquilo C₁-C₃. Esta reacción se puede efectuar, por ejemplo, en analogía a los siguientes métodos: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), loc cit. 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Vol. 43, 733 (1990); J. Org. Chem.,

Vol. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett.,
Vol. 34, 8267 (1993); loc.cit., Vol. 33, 413 (1992).

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

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

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

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

halógeno: fluoro, cloro, bromo e yodo;

alquilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales saturados con 1 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono, p.ej. alquilo C_1-C_8 , tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-
5 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-
10 etil-2-metilpropilo;

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 2, 4 ó 6 átomos de carbono (como los arriba mencionados), en cuyos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los
15 arriba mencionados: especialmente, halógenoalquilo 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 ó
20 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

alquenilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales no saturados con 2 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en una posición arbitraria, p.ej.
alquenilo C_2-C_8 , tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo,
25 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-

- metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

halógenoalquenilo: radicales hidrocarburo no saturados lineales o ramificados con 2 a 8 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en una posición arbitraria (como los arriba mencionados), pudiendo los átomos de hidrógeno en estos grupos estar sustituidos parcial o completamente por átomos de halógeno, como los arriba mencionados, especialmente, flúor, cloro y bromo;

alquínilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales no saturados con 2 a 4, 6, ó 8 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en una posición arbitraria, p.ej. alquínilo

- C₂-C₈**, 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;
- 10 **cicloalquilo**: grupos hidrocarburo mono o bicíclicos con 3 a 6 ó 8 miembros anulares de carbono, p.ej. cicloalquilo-C₃-C₈, como p.ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo;
- heterociclo saturado, parcialmente no saturado o aromático de cinco a diez miembros,
- 15 **que contiene de uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S**:
- **heterociclilo de 5 ó 6 miembros, que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, p.ej. 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-**
- 20 **tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 2-pirrolin-2-**
- 25 **piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-**

tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridacinilo, 4-hexahidropiridacinilo, 2-

hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo y 2-piperacinilo;

- heteroarilo de cinco miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de
5 nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno:
grupos heteroarilo pentacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener
de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo
de azufre o de oxígeno como miembros anulares, p.ej. 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-
tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-
10 isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo,
5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo y 1,3,4-triazol-
2-ilo;
- heteroarilo de seis miembros, que contiene de uno a tres o bien de uno a
15 cuatro átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo hexacíclicos, que además de átomos
de carbono pueden contener de uno a tres o bien de uno a cuatro átomos de nitrógeno
como miembros anulares, p.ej. 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridacinilo, 4-
piridacinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-piracinilo
- 20 alquileo: cadenas divalentes no ramificadas a partir de 3 a H grupos CH₂, por
ejemplo: CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;
- oxalquileo: cadenas divalentes no ramificadas a partir de 1 a 4 grupos CH₂, donde
una valencia está ligada por medio de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p.ej.
25 OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ y OCH₂CH₂CH₂CH₂;

oxialquilenoxi: cadenas divalentes no ramificadas a partir de 1 a 4 grupos CH₂, donde ambas valencias pueden estar ligadas por medio de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p.ej. OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ y OCH₂CH₂CH₂CH₂.

- 5 Dentro del ámbito de la presente invención están comprendidos los isómeros (R) y (S) y los racematos de los compuestos de la fórmula I, que presentan centros quirales.

Las formas de realización especialmente preferidas de los productos intermedios con respecto a las variables corresponden a aquellas de los radicales L y R³ de la fórmula

10 I.

En cuanto al uso a que están destinadas las triazolopirimidinas de la fórmula I son especialmente preferidos los siguientes significados de los sustituyentes, tanto por sí solos como también en combinaciones:

15

Son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde R¹ no significa hidrógeno.

Son preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa alquilo-C₁-C₈, alqueno-C₂-C₈ o halógenoalquilo-C₁-C₈.

20

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa un grupo A:



donde

Z^1 significa hidrógeno, fluoro o fluoroalquilo- C_1-C_6 .

Z^2 significa hidrógeno o fluoro, o

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

q es 0 ó 1; y

5 R^3 significa hidrógeno o metilo.

Además, son preferidos los compuestos I, en los que R^1 significa cicloalquilo- C_3-C_6 , que puede estar sustituido por alquilo- C_1-C_4 .

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

Son igualmente preferidos los compuestos I, en los que R^2 significa metilo o etilo.

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

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

25

Otro objeto preferido de la presente invención son compuesto I, en los que R¹ y R² forman junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo pirazol, que, opcionalmente, está sustituido por uno o dos halógeno, alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄, especialmente, por 3,5-dimetil o 3,5-di-(trifluorometilo).

5

Adicionalmente, son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa CH(CH₃)-CH₂CH₃, CH(CH₃)-CH(CH₃)₂, CH(CH₃)-C(CH₃)₃, CH(CH₃)-CF₃, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CH₂, ciclopentilo o ciclohexilo; R² es hidrógeno o metilo; o R¹ y R² forman juntos -(CH₂)₂CH(CH₃)(CH₂)₂, -(CH₂)₂CH(CF₃)(CH₂)₂-
10 o -(CH₂)₂O(CH₂)₂-.

Se prefieren compuestos I, en los que X significa halógeno, alquilo C₁-C₄, ciano o alcoxi C₁-C₄, por ejemplo, cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi, especialmente, cloro o metilo, sobre todo, cloro.

15

En la fórmula I, Hal significa, especialmente, cloro o fluoro.

Además, son preferidos los compuesto I, en los que L¹ significa alcoxi C₁-C₂, por ejemplo, metoxi; ciano; halógenometilo, p.ej. trifluorometilo o alcóxicarbonilo C₁-C₄,
20 p.ej. metóxicarbonilo. Son especialmente preferidos los compuestos, en los L² y L³ significan hidrógeno.

Igualmente, son preferidos los compuestos I, en los que L² significa alcoxi C₁-C₂, p.ej. metoxi; ciano; halógenometilo, p.ej. trifluorometilo o alcóxicarbonilo C₁-C₄, p. ej.

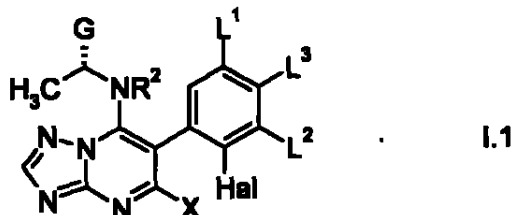
116

metoxycarbonilo. Muy preferentemente, L¹ y L³ en estos compuestos significan hidrógeno.

Además, son preferidos los compuestos I, en los que L³ significa hidrógeno.

5

Una modalidad preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I.1:



donde

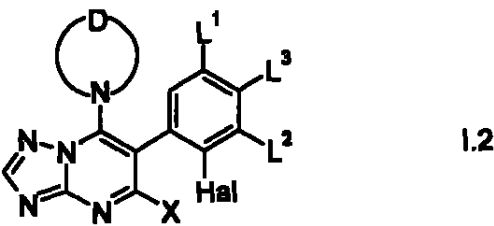
G significa alquilo C₂-C₆, especialmente, etilo, n- e i-propilo, n, sec, terc- butilo, y
 10 alcoximetilo C₁-C₄, especialmente, etoximetilo, o cicloalquilo C₃-C₆,
 especialmente, ciclopentilo o ciclohexilo,

R² es hidrógeno o metilo; y

X significa, clorto, metilo, ciano, metoxi o etoxi.

15

Otra modalidad de la invención se refiere a compuestos, en los que R¹ y R² forman
 junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un heterociclilo o heteroarilo de
 cinco o seis miembros, que está ligado por medio de N y que puede contener otro
 heteroátomo del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o uno o varios
 20 sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-
 C₆, halógenoalquenilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆,
 halógenoalqueniloxi C₃-C₆, alquilenoxi C₁-C₆ y oxi-alquilenoxi C₁-C₃. Estos compuestos
 corresponden, especialmente a la fórmula I.2,



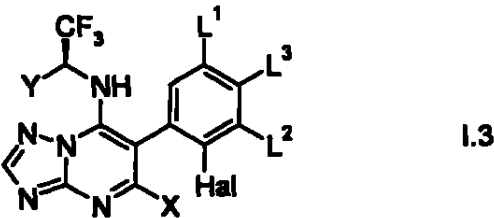
donde

D forma junto con el átomo de nitrógeno un heterociclilo o heteroarilo de cinco o
seis miembros, que está ligado por medio de N y que pueden contener otro
heteroátomo del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o uno o varios
sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y halógenoalcoxi
C₁-C₂; y

X significa, metilo, ciano, metoxi o etoxi.

10

Otra modalidad preferida de la invención son compuestos de la fórmula 1.3.



en la que Y significa hidrógeno o alquilo C₁-C₄, espeicalmente, metilo y etilo, y X
significa cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi.

15

Especialmente, con respecto a su uso son preferidos los compuestos I relacionados en
las siguientes Tablas. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente
son, considerados por si solo, independientemente de la combinación en que son
mencionados, una variante especialmente preferida del correspondiente sustituyente.

20

Tabla 1

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 12

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 13

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxycarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxycarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxycarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxycarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 20

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 21

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 22

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 26

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 27

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa trifluorometilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 29

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxicarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa clano, Hal significa cloro, L¹ significa metoxicarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 31

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxycarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 32

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxycarbonilo, L² y L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 33

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significan hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 34

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significan hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 35

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significan hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 36

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significan hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 37

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 39

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 40

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significan hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 41

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 42

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significan hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 43

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 44

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 45

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxicarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 46

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxycarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la

5 Tabla A

Tabla 47

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxycarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 48

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxycarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 49

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 50

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa

+28
128

hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 51

- 5 Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 52

- 10 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxi, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 53

- 15 Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 54

- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 55

- 25 Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa

hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 56

- 5 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa ciano, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 57

- 10 Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 58

- 15 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 59

- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 60

- 25 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹

130

significa hidrógeno, L² significa trifluorometilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 61

- 5 Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxicarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 62

- 10 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxicarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 63

- 15 Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxicarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 64

- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa hidrógeno, L² significa metoxicarbonilo, L³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 65

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 66

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 67

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 68

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 69

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 70

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 71

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 72

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 73

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 74

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 75

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 76

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 77

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 78

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 79

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 80

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 81

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 82

Compuestos de la fórmula I, en los que X ciano, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 83

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 84

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 85

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 86

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 87

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 88

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 89

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 90

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 91

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 92

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 93

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 94

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 95

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 96

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 97

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 98

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 99

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 100

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 101

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ y L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 102

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 103

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 104

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ y L² significan hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 105

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 106

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 107

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 108

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 109

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 110

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 111

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 112

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 113

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 114

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 115

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 116

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 117

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 118

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 119

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 120

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 121

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 122

Compuestos de la fórmula I, en los que X ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 123

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 124

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 125

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 126

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 127

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 128

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 129

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 130

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 131

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 132

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 133

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 134

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 135

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 136

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 137

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 138

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 139

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 140

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 141

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 142

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 143

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 144

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa ciano, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 145

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 146

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 147

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 148

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 149

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 150

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 151

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 152

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 153

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 154

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 155

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 156

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 157

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 158

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 159

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 160

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 161

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 162

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 163

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 164

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa fluoro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

151

Tabla 165

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 166

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 167

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 168

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 169

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 170

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 171

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 172

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ cloro y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 173

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 174

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 175

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 176

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa ciano y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 177

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 178

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 179

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla 180

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

5

Tabla 181

Compuestos de la fórmula I, en los que X cloro, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 182

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa ciano, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15

Tabla 183

Compuestos de la fórmula I, en los que X metilo, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

20

Tabla 184

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa metoxi, Hal significa cloro, L¹ significa metoxi, L² significa hidrógeno, L³ significa metoxicarbonilo y la combinación de R¹ y R² representan un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

25

Tabla A

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

156

No.	R ¹	R ²
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-45	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-48	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-54	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-57	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-63	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-66	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-72	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-75	$\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$	CH_2CH_3
A-76	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	H
A-77	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3
A-78	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_2CH_3
A-79	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
A-80	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3
A-81	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_2CH_3
A-82	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	H
A-83	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3
A-84	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_2CH_3
A-85	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	H
A-86	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3
A-87	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_2CH_3
A-88	$\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$	H
A-89	$\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$	CH_3
A-90	$\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$	CH_2CH_3
A-91	ciclopentilo	H
A-92	ciclopentilo	CH_3
A-93	ciclopentilo	CH_2CH_3
A-94	ciclohexilo	H
A-95	ciclohexilo	CH_3
A-96	ciclohexilo	CH_2CH_3
A-97	$\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$	H
A-98	$\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$	CH_3
A-99	$\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$	CH_2CH_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	$-(\text{CH}_2)_3\text{CHFCH}_2-$	
A-105	$-(\text{CH}_2)_2\text{CHF}(\text{CH}_2)_2-$	
A-106	$-\text{CH}_2\text{CHF}(\text{CH}_2)_2-$	
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 ¹	R ²
A-113		-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -
A-114		-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -
A-115		-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-
A-116		-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -
A-117		-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -
A-118		-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
A-119		-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -
A-120		-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -
A-121		-(CH ₂) ₆ -
A-122		-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -
A-123		-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -
A-124		-N=CH-CH=CH-
A-125		-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-
A-126		-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-

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

5 *basidiomicetos*. En parte son sistémicamente activos y pueden ser usados en la
 protección de plantas como fungicidas foliares y del suelo.

Son especialmente importantes para combatir múltiples hongos en diferentes plantas
 de cultivo, tales como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, plátanos,

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

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
- 15 • especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,

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

Los compuestos I son apropiados, además, para combatir hongos nocivos, tales como

- 20 *Paecilomyces variotii* en la protección de materiales (p.ej. madera, papel, dispersiones de pintura, fibras o bien tejidos) y en la protección de productos almacenados.

Los compuestos I se aplican, tratando los hongos o las plantas, semillas, materiales o el suelo a proteger frente a una infección fungosa con una cantidad activa fungicida de

los ingredientes activos. La aplicación puede efectuarse antes o después de la infección de los materiales, plantas o semillas por los hongos

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

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

- 10 En el tratamiento de las semillas se necesitan, generalmente, las cantidades de Ingrediente activo de 1 a 1000 g/100 kg, preferentemente, de 1 a 200 g por 100 kilogramos de semillas.

- En la protección de materiales o de productos almacenados, la cantidad de aplicación
15 de ingrediente activo depende de la naturaleza de la aplicación y del efecto deseado.
Las cantidades de aplicación generalmente usados para la protección de materiales varían, por ejemplo, de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, de 0,005 g a 1 kg, de ingrediente activo por metro cúbico del material tratado.

- 20 Los compuestos pueden ser transformados en las formulaciones acostumbradas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. La forma de aplicación depende del fin respectivo, pero en todo caso debe estar asegurada una dispersión fina y uniforme del compuesto según la invención.

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

- 5
- agua, disolventes aromáticos (p.ej. productos Solvesso, xileno), parafinas (p.ej. fracciones de petróleo), alcoholes (p.ej. metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos
- 10 grados y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,
- sustancias soporte, tales como polvos de piedras naturales (p.ej. caolines, arcillas, talco, tiza) y polvos de piedra sintéticos (p.ej. ácido silícico altamente disperso,
- 15 silicatos); emulsionantes, tales como emulsionantes no ionógenos y aniónicos (p.ej. éteres de polioxietileno-alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo) y dispersantes, tales como lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.

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

- nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricno etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales
- 5 lignino-sulfíticas y metilcelulosa.

- Sustancias apropiadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite directamente pulverizables son: fracciones de aceite mineral de punto de ebullición mediano hasta elevado, como p.ej. keroseno o aceite diesel,
- 10 además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

15

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

- Los granulados (p.ej. granulados recubiertos, impregnados o homogéneos) se pueden
- 20 preparar uniendo el ingrediente activo con un soporte sólido. hexilos de cargas sólidas son: tierras minerales, tales como silicagel, ácidos silícicos, geles silícicos, silicatos, talco, caolín, caliza, cal, bol, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, plásticos molidos, así como abonos, tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos
- 25 vegetales, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras

de nueces, polvos de celulosa u otros soportes sólidos.

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

Ejemplos de formulaciones son: 1. Productos para la dilución con agua

A) Concentrados solubles en agua (SL)

10

10 partes en peso de los principios activos son disueltos en agua o en un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se pueden adicionar humectantes u otros auxiliares. El ingrediente activo se disuelve cuando es diluido con agua.

15 B) Concentrados dispersables (DC)

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

20

C) Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de los principios activos son disueltos en xileno adicionando dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5%

respectivamente). Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión.

D) Emulsiones (EW, EO)

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

10

E) Suspensiones (SC, OD)

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

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

- 20 50 partes en peso de los principios activos son molidos finamente, adicionando dispersantes y humectantes, y transformadas en granulados dispersables en agua o solubles en agua mediante dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusora, torre de pulverización, lecho fluidizado). Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable del principio activo.

25

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

75 partes en peso de los principios activos son molidos en un molino de rotor-estator adicionando dispersante, humectantes y gel de sílica. Diluyendo con agua, se obtiene

5 una dispersión o solución estable con el principio activo.

2. Productos para la aplicación directa

H) Polvos pulverizables (DP)

10

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

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

0,5 partes en peso de los principios activos son molidos finamente y asociado con 95.5% de soporte. Métodos actuales son: extrusión, secado por pulverización y lecho fluidizado. Se obtienen granulados que pueden ser aplicados sin dilución.

20

J) Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

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

25

Los principios activos pueden ser usados como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas, por ejemplo, como soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite directamente pulverizables, pastas, polvos pulverizables, agente de rociado o de regado. Las formas de aplicación dependen enteramente del fin de aplicación, pero en todo caso hay que asegurar una distribución lo más fina posible del los ingredientes activos según la invención.

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

Las concentraciones en principio activo en las preparaciones listas para el uso pueden variar ampliamente. En general, varían de 0,0001 a 10%, preferentemente, de 0,01 a 1%.

Los principios activos también pueden ser usado con éxito en el procedimiento de volumen ultrabajo (ULV), pudiéndose aplicar formulaciones con más del 95% en peso de ingrediente activo, o aún el ingrediente activo sin aditivos.

A los principios activos se pueden adicionar varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, u otros pesticidas o bactericidas a los ingredientes activos, en caso dado, recién antes de la aplicación (mezcla de tanque). Estos agentes pueden ser mezclados con los agentes según la invención en una relación ponderal de 5 1:10 hasta 10:1.

Cuando se usan como fungicidas, los fungicidas de la invención pueden estar presentes también junto con otros ingredientes activos, por ejemplo, con herbicidas, insecticidas, reguladores del crecimiento, fungicidas u otros fertilizantes. Cuando se 10 mezclan los compuestos I o las composiciones según la invención como fungicidas con otros fungicidas, entonces se alcanza, frecuentemente, ampliar el espectro de acción.

La siguiente lista de fungicidas con los que se pueden mezclar los compuestos según 15 la invención sirve para ilustrar las combinaciones posibles, pero no debe entenderse como limitativa:

- acilalaninas, tales como benalaxilo, matalaxilo, ofurace, oxadixilo,
- derivados de amina, tales como aldimorf, dodine, dodemorf, fenpropimorf,
- 20 fenpropidina, guazatina, iminoctadina, esprixamina, tridemorf,
- anilino pirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirim o ciprodinilo,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polloxina o estreptomicina,
- azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol,
- 25 dinitroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol,

- flutriafol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol,
- dicarboximidas, tales como iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,
 - 5 • ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb,
 - compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, benomilo, boscalida, carbendazima, carboxima, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, dítianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir,
 - 10 isoprotiolano, mepronilo, nuarimol, probenazol, proquinazida, pirfenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina,
 - fungicidas de cobre, tales como caldo de burdeos, acetato de cobre, oxidoruro de cobre, sulfato de cobre básico,
 - 15 • 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,
 - 20 clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida,

- estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picostrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico, tales como captan, diclofluanida, folpet,
- 5 toliifluanida,
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

Ejemplos de síntesis

- 10 Las prescripciones indicadas en los siguientes ejemplos de síntesis se pueden usar, variando en forma correspondiente los compuestos de partida, para la generación de otros compuestos I. Los compuestos así obtenidos se indican en las siguientes Tablas con sus datos físicos.
- 15 Ejemplo 1: Preparación de 5-cloro-6-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-7-(4-metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina
- a) 2-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-malonato de dimetilo
- 20 Una mezcla de 5,1 g (0,03 mol) de dimetilmalonato de potasio y 1 g de bromuro de cobre en 40 ml de éter dimetílico de dietilenglicol se agitó aprox. una hora a 100°C. A continuación, se agregaron 2,43 g (0,01 mol) de 2-fluoro-3-trifluorofenil-bromobenceno y se agitó aprox. 3 horas a 100°C. Después de haber adicionado 3 g dimetilmalonato de potasio se agitó todavía 3 horas a 110°C.

170

Entonces se acidificó la mezcla de reacción con ácido clorhídrico concentrado y se extrajo con éter metil-t-butílico (MTBE). Las fases orgánicas reunidas se secaron y se eliminó el disolvente. El residuo obtenido se absorbió en mezclas de ciclohexano/éster acético y se filtró sobre silicagel. El eluato se libró del disolvente y el residuo se secó.

5 Como residuo se obtuvieron 2,7 g del compuesto indicado en el título.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ in ppm): 7,75 (t, 1H); 7,6 (t, 1H); 7,3 (t, 1H); 5,1 (s, 1H); 3,8 (s, 6H).

b) 5,7-dihidroxi-6-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina

10

Una solución de 2,7 g (9,2 mmol) de 2-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-malonato de dimetilo (del Ejemplo 1a) y 0,8 g (9,5 mmol) de aminotriazol en 2,1 g de tributilamina se agitaron aprox. 3 horas a aprox. 170°C, destilándose el metanol. A continuación, se enfrió la mezcla de reacción a aprox. 80-100°C y se mezcló con solución de hidróxido

15 sódico al 20 %. La fase acuosa se extrajo con MTBE y se acidificó con ácido clorhídrico concentrado. La fase acuosa se extrajo con cloruro metilénico, la fase acuosa se filtró, el residuo se disolvió en tetrahidrofurano. Las fases orgánicas reunidas se secaron y se libraron del disolvente. El residuo contenía 2,0 g del compuesto indicado en el título como sólido de color beige, que se usó sin purificación

20 ulterior en la próxima reacción.

c) 5,7-Dicloro-6-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina

Una solución de 2,0 g (6,7 mmol) de 5,7-dihidroxi-6-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-

25 1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina (del Ejemplo 1b) en 30 ml oxiclورو fosfórico se agitaró

aprox. 5 horas a 100°C. A continuación, se destiló el oxidloruro fosfórico excesivo, se absorbió el residuo en cloruro metilénico y agua y se neutralizó la mezcla con NaHCO₃. A continuación, se separaron las fases y se extrajo la fase acuosa con cloruro metilénico. Ahora se secaron las fases orgánicas reunidas y se destiló el
5 disolvente. Tras cromatografía en silicagel con mezclas de ciclohexano/éster acético se obtuvieron 0,9 g del compuesto indicado en el título.

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,65 (s, 1H); 8,4 (t, 1H); 7,6 (t, 1H); 7,5 (t, 1H).

10 1d) 5-Cloro-6-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-7-(4-metilpiperidinil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina

Una solución de 0,25 g (0,7 mmol) 5,7-dicloro-6-(2-fluoro,3-trifluorometil-fenil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina (del Ejemplo 1c), 0,106 g (146 µl, 1,05 mmol) de trietilamina y
15 0,104 g de 4-metilpiperidina (como solución 0,8 m en cloruro metilénico) en 4 ml de cloruro metilénico se agitaron 5 horas a 35°C y 15 horas a 20-25°C. La mezcla de reacción se extrajo con ácido clorhídrico diluido y solución de sal común. La fase orgánica se secó y se libró del disolvente. Quedaron 0,156 g del compuesto indicado en el título como masa cristalina pálida de p.f. 166-170°C.

20

HPLC/MS: R_t=3,929 min; m/z=414 (M⁺+H)

Columna de HPLC: columna de RP-18 (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania)

PF 55192

76

Eluyente: acetonitrilo + 0,1% ácido trifluoroacético (TFA)/ agua + 0,1% TFA (gradiente de 5:95 a 95:5 in 5 min), 40°C.

MS: Quadrupol Elektrospray Ionisation, 80 V (modo positivo)

Tabla I – Compuestos de la fórmula I

173

PF 66192

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f. [°C])
I-1	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	CF ₃	H	H	166-170
I-2	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	CF ₃	H	139-143
I-3	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	144-147
I-4	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	135-137
I-5	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	100-130
I-6	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	aceite
I-7	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	CF ₃	H	110-115
I-8	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	CF ₃	H	H	163-168
I-9	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	CF ₃	H	H	159-161
I-10	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	CF ₃	H	107-113
I-11	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	159
I-12	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	CF ₃	H	aceite
I-13	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	73-94
I-14	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	70-92
I-15	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	77-115
I-16	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	171-177
I-17	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	66-105
I-18	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	66-105
I-19	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	135-147
I-20	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	162-169

77

173

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f. [°C])
I-21	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	121-126
I-22	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	166-170
I-23	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	-(C=O)-OCH ₃	H	H	135-165
I-24	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	OCH ₃	H	H	158-165
I-25	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	99-105
I-26	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	OCH ₃	H	102-108
I-27	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	147-151
I-28	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	aceite
I-29	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	174-179
I-30	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	aceite
I-31	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	133-137
I-32	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	aceite
I-33	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	148-149
I-34	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	aceite
I-35	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	aceite
I-36	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	170-175
I-37	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	aceite
I-38	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	H	OCH ₃	H	aceite
I-39	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	-CN	H	H	213
I-40	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	H	CN	H	157
I-41	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	H	-(C=O)-OCH ₃	H	186-187

78

17X

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f. [°C])
I-42	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	H	OCH ₃	H	133-135
I-43	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	CF ₃	H	H	155-157
I-44	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	H	CF ₃	H	198-197
I-45	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	175-183
I-46	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	150-154
I-47	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	175-177
I-48	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	112-120
I-49	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	150-160
I-50	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	aceite
I-51	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	276-279
I-52	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	170-182
I-53	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	144-148
I-54	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	148-153
I-55	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	250-253
I-56	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-OCH ₃	72-78
I-57	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-OCH ₃	87-102
I-58	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	89-106
I-59	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	213-217
I-60	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	179-182
I-61	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	184-188
I-62	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	88-94

79

IF

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f. [°C])
I-63	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	127-143
I-64	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	aceite
I-65	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	141-146
I-66	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	aceite
I-67	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	196-200
I-68	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	97-100
I-69	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	256-260
I-70	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	222-228
I-71	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	Cl	aceite
I-72	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	aceite
I-73	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	112-114
I-74	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	CN	192
I-75	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	aceite
I-76	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	aceite
I-77	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	aceite
I-78	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	aceite
I-79	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	99
I-80	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CN	H	CN	195-202
I-81	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃	105-112
I-82	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	CN	H	CN	188-201
I-83	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	112

ff

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f. [°C])
I-84	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	CN	aceite
I-85	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	OCH ₃	OCH ₃	168-174
I-86	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	CN	aceite
I-87	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	128-129
I-88	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	159-162
I-89	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-CN	H	CN	aceite
I-90	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	145-146
I-91	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	-CN	H	CN	243-245
I-92	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	-CN	H	CN	243-247
I-93	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	-CN	H	CN	154-157
I-94	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	129-131
I-95	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-CN	H	CN	aceite
I-96	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	-OCH ₃	H	OCH ₃	214-216
I-97	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	-OCH ₃	H	Cl	177-178
I-98	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	F	-OCH ₃	H	OCH ₃	182-184
I-99	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	168-170
I-100	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	182-184
I-101	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-102	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	176-178
I-103	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	175-177
I-104	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	210-216

81

177

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f.[°C])
I-105	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	186-189
I-106	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-OCH ₃	H	Cl	118-121
I-107	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	190-193
I-108	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	aceite
I-109	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	F	H	OCH ₃	Cl	210-212
I-110	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	193-195
I-111	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	aceite
I-112	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	aceite
I-113	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl	193
I-114	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	CN	aceite
I-115	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	203-204
I-116	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	153-154
I-117	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	165-166
I-118	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-119	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-120	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	214-216
I-121	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	aceite
I-122	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	F	aceite
I-123	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-124	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	156-157
I-125	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	139

82

PK

179

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f.[°C])
I-128	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	188-189
I-127	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	179-180
I-128	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	142-143
I-129	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-130	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-131	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	aceite
I-132	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	247-248
I-133	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	215-217
I-134	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	205-207
I-135	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	204-206
I-136	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	225-228
I-137	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	204-206
I-138	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	CN	128-128
I-139	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	aceite
I-140	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	176-177
I-141	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-142	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-143	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-144	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	173-174
I-145	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-146	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	aceite

180

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f.[°C])
I-147	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	aceite
I-148	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-149	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-150	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	aceite
I-151	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-152	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-153	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	aceite
I-154	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	F	aceite
I-155	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	-(C=O)-OCH ₃	aceite
I-156	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	CN	249-250
I-157	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	aceite
I-158	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-159	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-160	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-161	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-162	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	aceite
I-163	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	aceite
I-164	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	Cl	aceite
I-165	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-166	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite
I-167	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	aceite

8

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f. [°C])
I-168	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	136-138
I-169	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	Cl	175-176
I-170	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	171-178
I-171	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	120-153
I-172	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	58-78
I-173	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	138-144
I-174	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	180-189
I-175	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	170-176
I-176	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	aceite
I-177	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	163-188
I-178	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	145-165
I-179	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	116-123
I-180	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	60-88
I-181	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	aceite
I-182	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	CF ₃	H	aceite
I-183	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-184	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	72-78
I-185	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-186	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-187	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-188	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	F	H	CF ₃	H	222-227

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f.[°C])
I-189	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-190	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-181	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	F	CF ₃	H	H	aceite
I-182	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	OCH ₃	H	aceite
I-193	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	74-143
I-194	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	aceite
I-195	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	aceite
I-196	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	aceite
I-197	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	169-171
I-198	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	148-153
I-199	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	88-90
I-200	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	180-182
I-201	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	-(C=O)-OCH ₃	H	175-177
I-202	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	84-89
I-203	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	aceite
I-204	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	aceite
I-205	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	-(C=O)-OCH ₃	H	H	aceite
I-206	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H	H	147-150
I-207	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	H	188-189
I-208	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CN	H	H	124-125
I-209	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	199-200

88

182

No.	R ¹	R ²	X	Hal	L ¹	L ²	L ³	Datos físicos (¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ [ppm]); p.f.[°C])
I-210	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	CN	H	H	152-153
I-211	CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	aceite
I-212	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	H	204
I-213	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -		Cl	Cl	H	CN	H	189-190
I-214	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -		Cl	Cl	H	CN	H	aceite
I-215	(R) -CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	aceite
I-216	(R) -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	CN	H	H	aceite
I-217	CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	aceite
I-218	CH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	aceite
I-219	CH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	Cl	CN	H	H	aceite
I-220	(S) -CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	Cl	CN	H	H	aceite

183

84

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

Los ingredientes activos se prepararon como solución madre con 25 mg de principio
5 activo, que se completó con una mezcla de acetona y/o DMSO y el emulsionante Uniperol® EL (humectante con efecto emulsionante y dispersante basado en alquifenoles etoxilados) en la relación en volumen de disolvente:emulsionante de 99 : 1 ad 10 ml. A continuación, se completó con agua ad 100 ml. Esta solución madre se diluyó con la mezcla de disolvente-emulsionante-agua a la concentración en principio
10 activo abajo indicada.

Ejemplo de aplicación 1 – Eficiencia contra la podredumbre en hojas de pimientos causado por *Botrytis cinerea* en una aplicación protectora

15 Plántulas de pimiento de la variedad "Neusiedler Ideal Elite" se pulverizaron hasta chorrear, cuando se habían desarrollado bien las primeras dos a tres hojas, con una suspensión acuosa de la concentración en principio activo abajo indicada. Al día siguientes se inocularon las plantas tratadas con una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea*, que contenía $1,7 \times 10^8$ esporas/ml en una solución acuosa al 2 % de biomalta. A
20 continuación, se colocaron las plantas de ensayo en una cámara climática de 22 a 24°C, oscura y con alta humedad del aire. Después de cinco días se pudo determinar visualmente la extensión de la infección fungosa sobre las hojas en por cien.

En este ensayo, las plantas tratadas con 63 ppm de los principios activos I-3, I-4, I-7, I-
25 13 a I-16, I-18 a I-22, I-24 a I-26, I-28, I-30 a I-32, I-34, I-38, I-40, I-42, I-45, I-47 a I-49,

I-52, I-54 hasta I-57, I-88, I-89, I-108I-114, I-116, I-121, I-138, I-137, I-140, I-144, I-149, I-159, I-167, I-172, I-174, I-176, I-179, I-180, I-182 a I-185, I-190, I-191, I-193, I-199, I-202, I-207 a I-209, o bien I-215 estaban infectadas en, como máximo, un 30%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 85 %.

5

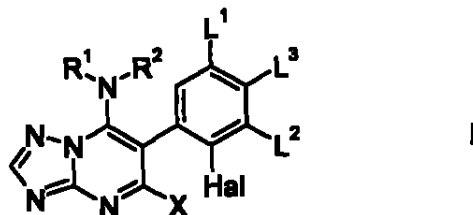
Ejemplo de aplicación 2: Eficiencia contra la marchitez temprana del tomate causada por *Alternaria solani*

Las hojas de plantas crecidas en macetas de la variedad "Goldene Königin" se
10 pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa de la concentración en principio activo abajo indicada. Al día siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani* en solución de biomalta al 2 % con una densidad de $0,17 \times 10^6$ esporas/ml. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 20 y 22°C. Después de 5 días, la enfermedad se
15 había desarrollado tan fuertemente en las plantas de control no tratadas, pero infectadas, que la infestación pudo ser determinada visualmente en por cien.

En este ensayo, las plantas tratadas con 63 ppm de los principios activos I-14, I-20, I-22, I-24, I-26, I-28, I-30, I-33, I-34, I-36, I-45, I-47, I-54, I-60, I-61, I-98, I-103, I-105,
20 I-107, I-114, I-159, I-167, o bien I-182 estaban infectadas, como máximo, en un 30%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectada en hasta un 90 %.

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



5 en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹, R² significan, independientemente, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈,
 cicloalquilo C₃-C₈, halógenocicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₈,
 halógenoalquenilo C₂-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, halógenocicloalquenilo C₃-
 10 C₈, alquinilo C₂-C₈, halógenoalquinilo C₂-C₈ o fenilo, naftilo, o un
 heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco o seis
 miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S,

R¹ y R² también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que
 15 están ligados, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que
 está ligado por medio de N y pueden contener uno a tres heteroátomos
 adicionales del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o contener uno
 o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo,
 C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, -halógenoalquenilo C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈,
 20 halógenoalcoxi C₁-C₈, alqueniloxi C₃-C₈, halógenoalqueniloxi C₃-C₈,
 alquilenilo C₁-C₈ y oxi-alquilenoxi C₁-C₈;

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

- 5 R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , halógenoalcoxi C_1-C_6 , alcoxycarbonilo 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 , halógenoalquenilo C_2-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , halógenoalqueniloxi C_3-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halógenoalquinilo C_2-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , halógenoalquiniloxi C_3-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , C_3 -cicloalquenoxi C_6 , oxialquilenoxi C_1-C_3 , fenilo, naftilo, heterociclo saturado, parcialmente
- 10 insaturado o aromático de cinco o diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S, pudiendo estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos por su parte estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^b :
- 15 R^b es halógeno, ciano, nitro, hidroxí, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo,
- 20 dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, conteniendo los grupos alquilo en estos radicales 1 a 6 átomos de carbono y los grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales 2 a 8 átomos de carbono;
- 25 y/o uno a tres de los radicales siguientes:

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterocíclico, heterocíclico, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros anulares; arilo, arilo, ariltio, aril-alcoxi C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆, hetarilo, hetarilo, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetarilo 5 ó 6 miembros anulares, pudiendo los sistemas cíclicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo;

10 Hal es halógeno;

L¹, L² significan hidrógeno, ciano, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆ o C(=O)A, siendo preciso que por lo menos un grupo L¹ o L² no es hidrógeno;

15

A es hidrógeno, hidroxilo alquilo, C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆ o di-(C₁-C₆-alquil)amino;

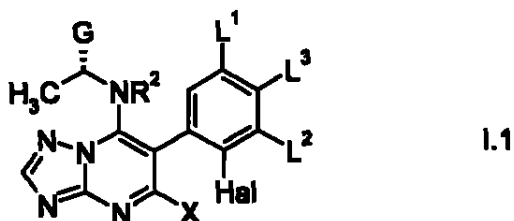
20

L³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆;

X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₂.

25 2. Compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, donde R¹ no es hidrógeno.

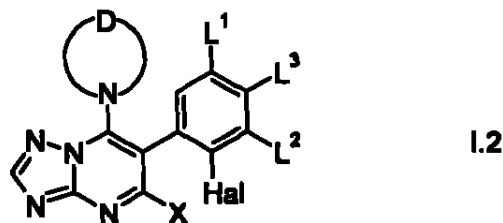
3. Compuestos de la fórmula 1.1,



en la que

- 5 G significa alquilo C₂-C₆, alcoximetilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;
 R² es hidrógeno o metilo y
 X es cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi y
 L¹ a L³ y Hal tienen las definiciones indicadas para la fórmula 1.

10 4. Compuestos de la fórmula 1.2,



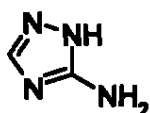
donde

- 15 D forma junto con el átomo de nitrógeno un heterociclilo o heteroarilo de
 cinco o seis miembros, que está ligado por medio de N y que contiene otro
 heteroátomo adicional del grupo: O, N y S como miembros anulares, y/o
 lleva uno o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi
 C₁-C₄ y halógenoalquilo C₁-C₂;
 X es cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi y
 20 L¹ a L³ y Hal tienen las definiciones indicadas para la fórmula 1.

190

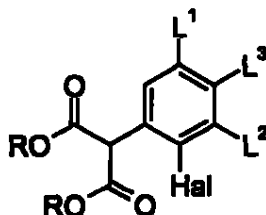
5. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, en la que X significa halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalacoxi C₁-C₂, por reacción de 5-aminotriazol de la fórmula II

5



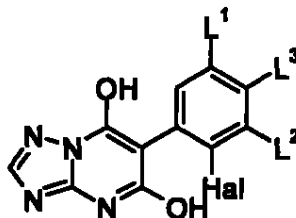
II

con malonatos de fenilo de la fórmula III,



III

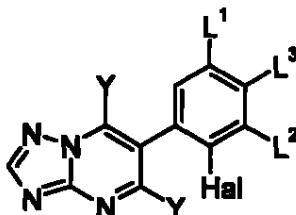
en la que R significa alquilo, en dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV,



IV

10

halogenación en compuestos de dihalógeno de la fórmula V,



V

en la que Y significa halógeno, y transformación de V con aminas de la fórmula

VI



VI

15

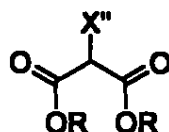
en compuestos de la fórmula I, donde X significa halógeno, en caso de desearlo

para la obtención de compuestos I, en los que X significa clano, alcoxi, C₁-C₄ o halógenoalacoxi C₁-C₂, transformación de compuestos I, en los que X significa halógeno, con compuestos de la fórmula VII,



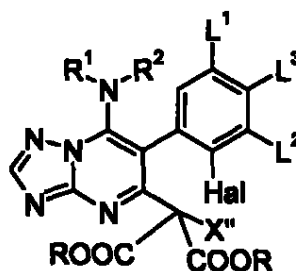
VII

- 5 que, dependiendo del grupo X' a incorporar, es un cianuro inorgánico, un alcoxilato o un halógenoalcoxilato y donde M representa un catión amonio, tetraalquilamonio, metal alcalino o metal alcalinotérreo y, en caso de desearlo para la preparación de compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, donde X significa alquilo, por reacción de los compuestos I, en los que X representa
- 10 halógeno, con malonatos de la fórmula VIII,



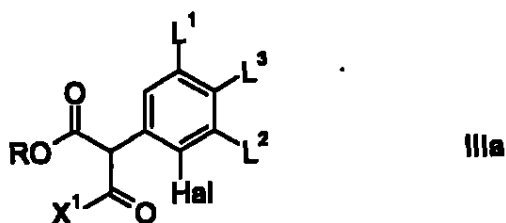
VIII

donde X'' significa hidrógeno o alquilo C₁-C₃ y R significa alquilo C₁-C₄, dando compuestos de la fórmula IX

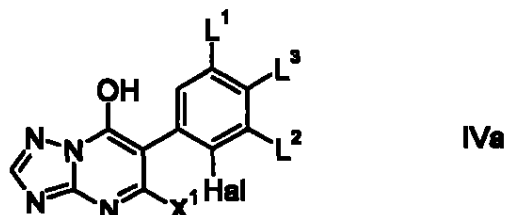


IX

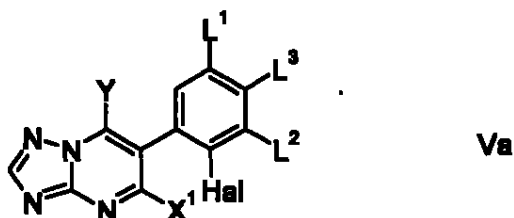
- 15 y descarboxilación en compuestos I, en los que X significa alquilo.
6. Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, en la que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄, por reacción 5-aminotriazol de la fórmula II según la reivindicación 5 con ceto ésteres de la
- 20 fórmula IIIa,



en la que X¹ significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄ y R significa alquilo C₁-C₄, en 5-alquil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas de la fórmula IVa,



5 halogenación de IVa en 7-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula Va,



en la que Y significa halógeno y transformación de Va con aminas de la fórmula VI según la reivindicación 5 en compuestos I, en los que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄.

10

7. Compuestos de las fórmulas IV, IVa, V y Va según las reivindicaciones 5 y 6.

8. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

15

9. Semillas, que contienen 1 a 1000 g de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1 por 100 kg.

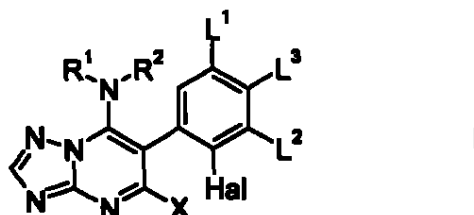
10. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se
tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a
la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la
5 fórmula I según la reivindicación 1.

6-(2-Halógenofenil)-triazolopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

Resumen

5

Triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 R¹, R² es alquilo, halógenoalquilo, cicloalquilo, halógenocicloalquilo, alquenilo, halógenoalquenilo, cicloalquenilo, halógenocicloalquenilo, alquinilo, halógenoalquinil o fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S,

15

R¹ y R² también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está ligado por medio de N y que puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo: O, N y S como miembros anulares y puede estar sustituido según la

20

descripción;

L¹, L² significan hidrógeno, ciano, halógenoalquilo, alcoxi, alqueniloxi o C(=O)A, siendo

preciso que por lo menos un grupo L¹ o L² no signifique hidrógeno;

A es hidrógeno, hidroxilo, alquilo, alcoxi, halógenoalcoxi, alquilamino C₁-C₆ o dialquilamino;

5

L³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, halógenoalquilo, alcoxi o alcoxycarbonilo;

X es halógeno, ciano, alquilo, halógenoalquilo, alcoxi o halógenoalcoxi;

10 procedimiento y productos intermedios para la preparación de estos compuestos, productos que los contienen, así como el uso de los mismos para combatir hongos nocivos fitopatógenos.

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

196

PCT INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055192NI	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA16	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014328	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 16.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 18.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04, A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 38 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 7 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☒ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 6 Blätter; dabei handelt es sich um ☐ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/dies elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerisierbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 602 der Verwaltungsvorschriften).		
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids ☐ Feld Nr. II Priorität ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☒ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 17.10.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 02.02.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Guspanova, J Tel. +49 89 2399-7834 	

Feld Nr. I 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

1-62

In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-11

eingegangen am 17.12.2005 mit Schreiben vom 16.12.2005

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
 - ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
 - ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

siehe Beiblatt

Zu Punkt II**Priorität**

Das Dokument D6, das am 21. Mai 2004 veröffentlicht wurde, wird in diesem Bescheid nicht berücksichtigt. Es kann jedoch nach dem Eintritt in die europäische Phase für die Beurteilung von Neuheit der vorliegenden Anmeldung relevant sein.

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Relevante Dokumente

In diesem Bescheid werden folgende, im Recherchenbericht zitierte Dokumente D1- D6 genannt; die Numerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

- D1: WO 02/50077 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; GEBAUER, OLAF; ELBE, HANS-LUDWIG; HENRICH, M) 27. Juni 2002 (2002-06-27)
- D2: WO 03/091254 A (BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; GEBAUER, OLAF; GREUL, NICO, JOER) 6. November 2003 (2003-11-06)
- D3: EP-A-0 550 113 (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07)
- D4: WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16. Januar 2003 (2003-01-16)
- D5: WO 03/080615 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 2. Oktober 2003 (2003-10-02)
- D6: WO 2004/041824 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 21. Mai 2004 (2004-05-21)

2. Änderungen

Der Anmelder hat einen geänderten Anspruchssatz eingereicht. Alle eingereichten Änderungen bringen keine Sachverhalte ein, die im Widerspruch zu Artikel 19(2) PCT über den Offenbarungsgehalt der Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgehen würden.

3. Neuheit

Mit der Streichung der Bedeutung "Halogenalkyl" aus dem Umfang der Gruppen L^1 - L^3 wurde die Neuheit der vorliegenden Anmeldung wiederhergestellt.

Die vorliegende Anmeldung betrifft 7-Amino-6-(2-halophenyl)-triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I (Ansprüche 1-5), Verfahren zu ihrer Herstellung (Ansprüche 6 und 7), Zwischenprodukte (Anspruch 8), Verwendung von Verbindungen der Formel I zur Bekämpfung von Schadpilzen (Anspruch 9), Saatgut enthaltend diese Verbindungen (Anspruch 10) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen (Anspruch 11).

Das Dokument D1 offenbart eine breite Familie von Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I) (Anspruch 1), die fungizide Wirkung aufweisen (Seite 4, Absatz 1). Die Definitionen der Substituenten in der allgemeinen Formel (I) aus D1 überlappen sich zwar mit den Definitionen der Substituenten der vorliegenden Formel I, das Überlappungsgebiet ist jedoch nicht explizit durch die Beispiele gestützt. Die Verbindungen der Beispiele aus dem Dokument D1 weisen im Vergleich zu den vorliegenden Verbindungen ein anderes Substitutionsmuster sowohl der 7-Amino-Gruppe als auch der Phenylgruppe auf. Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1-11 ist somit als neu gegenüber D1 angesehen.

Das Dokument D2 offenbart eine breite Familie von Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I) (Anspruch 1), die fungizide Wirkung aufweisen (Seite 13, Absatz 1). Die Definitionen der Substituenten in der allgemeinen Formel (I) aus D2 überlappen sich zwar mit den Definitionen der Substituenten der vorliegenden Formel I, das Überlappungsgebiet ist jedoch nicht explizit durch die Beispiele gestützt. Die Verbindungen der Beispiele aus dem Dokument D2 weisen im Vergleich zu den vorliegenden Verbindungen ein anderes Substitutionsmuster sowohl der 7-Amino-Gruppe als auch der Phenylgruppe auf. Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1-11 ist somit als neu gegenüber D2 angesehen.

Die Dokumente D3 und D4 offenbaren u.a. 7-Amino-6-(substituiertes)-Phenyl-triazolopyrimidine, die jeweils durch eine allgemeine Formel definiert sind. Alle diese Verbindungen werden zur Bekämpfung von Schadpilzen verwendet.

Der einzige Unterschied zwischen den offenbarten Verbindungen aus dem Stand der Technik D3/D4 und den vorliegenden Verbindungen liegt im Charakter des Substitutionsmuster am Phenylring. Das essentielle technische Merkmal der vorliegenden Verbindungen, nämlich ein Halogenatom in ortho-Position und ein weiteres Substituent L^1/L^2 (definiert im vorliegenden Anspruch 1) in meta-Position am Phenylring, ist in den Verbindungen der Dokumente D3 und D4 nicht vorhanden. Der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber dem Stand der Technik D3 und D4 neu.

Das Dokument D5 offenbart Triazolopyrimidine der allgemeiner Formel (I), die sich von der vorliegenden Formel dadurch unterscheidet, das sie keine Aminogruppe in der Stellung 7 des Triazolopyrimidin-Grundgerüsts trägt, sondern lediglich Kohlenwasserstoffresten (siehe Definition für den Substituenten R^1). Die Verbindungen des Dokumenten D5 werden zur Bekämpfung von Schadpilzen verwendet. Der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber dem Stand der Technik D5 neu.

Zusammengefaßt, die vorliegenden Ansprüche 1-11 sind als neu gegenüber dem Stand der Technik angesehen, gemäß Artikel 33(2) PCT.

4. Erfinderische Tätigkeit

Die der Erfindung zugrundeliegende Aufgabe war es, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Das Dokument D1 oder D2 können als nächstliegender Stand der Technik angesehen werden. Diese Dokumente offenbaren Verbindungen, die sich von den vorliegenden Verbindungen strukturell lediglich im Substitutionsmuster 6-Phenyl-Gruppe unterscheiden. Die bevorzugten Verbindungen aus D1/D2 tragen zwei Substituenten auf der Aminogruppe in der Stellung 7 und ein anderes Substitutionsmuster der 6-Phenyl-Gruppe als die vorliegenden Verbindungen.

Die Lösung der obengenannten Aufgabe beruht in der Herstellung von Verbindungen, die durch allgemeine Formel I.1 im Anspruch 3 definiert sind. Die Daten sind auf den Seiten 61, Zeilen 26-31 und auf der Seite 62, Zeilen 4-7 gegeben. Die Vergleichsdaten wurden mit dem Schreiben vom 16.12.2005 nachgereicht.

Die im Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagene Lösung kann aus folgenden Gründen als erfinderisch betrachtet werden (Artikel 33(3) PCT):
Ausgegangen von D1/D2-Verbindungen, der Fachmann hätte das Substitutionsmuster der 6-Phenyl-Gruppe ändern müssen, um zu den vorliegenden Verbindungen zu gelangen. Dokumente D1 und D2 schlagen verschiedene Modifizierungen vor (siehe die Substituenten R³ in D1 und R in D2). Diese ist für den Fachmann als eine übliche Vorgehensweise angesehen. Der Fachmann würde versuchen weitere Substituenten (bekannt aus D1 und D2) an die 6-Phenyl-Gruppe der Verbindungen aus D1/D2 einzuführen, wobei er die gleiche oder ähnliche Wirkung bei solchen neuen Derivaten erwarten würde. Der Fachmann würde wahrscheinlich bei einer solchen Modifikation keine erhebliche Wirkungsänderung erwarten. Deswegen die vorliegenden Verbindungen mit einer erhöhten Aktivität (gemäß nachgereichten Vergleichsdaten) werden als nicht naheliegend angesehen.

Somit wird der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung als erfinderisch angesehen, gemäß Artikel 33(3) PCT.

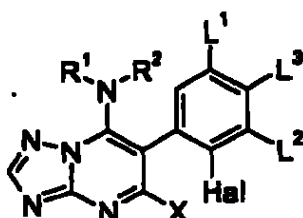
Zu Punkt VI
Bestimmte angeführte Unterlagen

Bestimmte veröffentlichte Unterlagen

Anmelde Nr. Patent Nr.	Veröffentlichungsdatum (Tag/Monat/Jahr)	Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (zu Recht beansprucht) (Tag/Monat/Jahr)
WO 04/041824	21.05.2004	04.11.2003	07.11.2002

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 In der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-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,

15 R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclidyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy, C₃-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Halogenalkenyloxy, C₁-C₈-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann;

20 R¹ und/oder R² können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

25 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy, C₁-C₈-Alkoxycarbonyl, C₁-C₈-Alkylthio, C₁-C₈-Alkylamino, Di-C₁-C₈-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Halogenalkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl, C₃-C₈-Alkynyloxy, C₃-C₈-Halogenalkinyloxy, C₃-C₈-Cycloalkoxy, C₃-C₈-Cycloalkenoxo, C₁-C₃-Oxyalkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

30

35

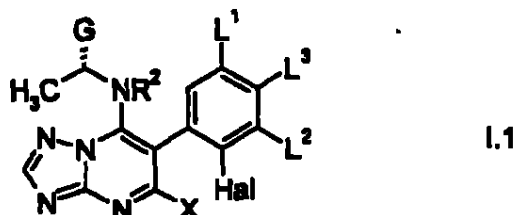
wobei diese aliphatischen, allcyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

- 5 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- 10
- 15 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- 20 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- C_1-C_6 -alkoxy, Aryl- C_1-C_6 -alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können;
- 25
- Hal Halogen;
- 30 L^1, L^2 Wasserstoff, Cyano, C_1-C_6 -Alkoxy, C_3-C_6 -Alkenyloxy oder $C(=O)A$, wobei mindestens eine Gruppe L^1 oder L^2 ungleich Wasserstoff ist;
- A Wasserstoff, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, C_1-C_6 -Alkylamino oder Di- $(C_1-C_6$ -Alkyl)amino;
- 35 L^3 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Alkoxycarbonyl;
- X Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_2 -Halogenalkoxy.
- 40 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der R^1 nicht Wasserstoff bedeutet.

65

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei R² Wasserstoff, Methyl oder Ethyl bedeutet.
4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.1 entsprechen,

5



in der

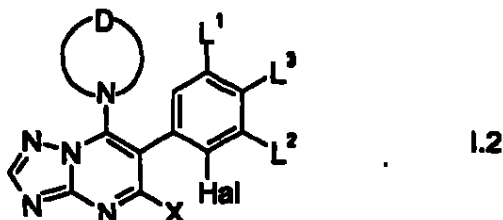
G C₂-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyethyl, oder C₃-C₈-Cycloalkyl;

R² Wasserstoff oder Methyl; und

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und L¹ bis L³ und Hal gemäß Anspruch 1 definiert sind.

10

5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.2 entsprechen,



15

in der

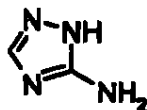
D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann;

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und

L¹ bis L³ und Hal gemäß Anspruch 1 definiert sind.

20

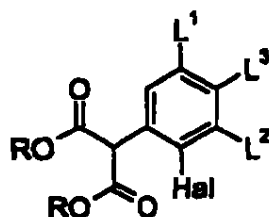
- 25 6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



II

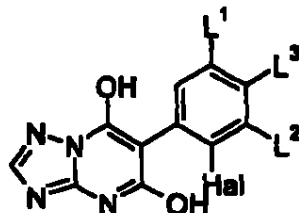
mit Phenymalonaten der Formel III,

66



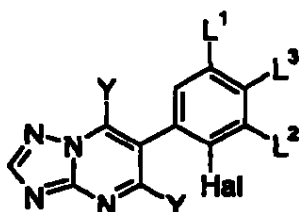
III

In der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,



IV

Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



V

5

in der Y für Halogen steht und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



VI

zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,

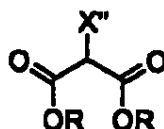
10

M-X'

VII

die, je nach der einzuführenden Gruppe X', ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxyat oder ein Halogenalkoxyat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und, gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,

15

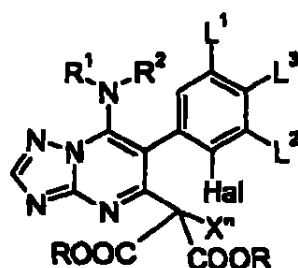


VIII

20

In der X'' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX

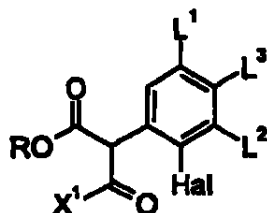
67



IX

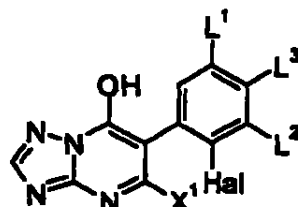
und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

- 5 7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 5 mit Ketoestern der Formel IIIa,



IIIa

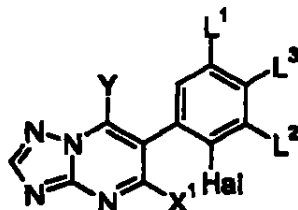
in der X¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl und R für C₁-C₄-Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazo-pyrimidinen der Formel IVa,



IVa

10

Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazolo-pyrimidinen der Formel Va,



Va

15

in der Y für Halogen steht und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 5 zu Verbindungen I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht.

8. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 6 und 7.

- 20 9. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

68

10. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.
11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

5

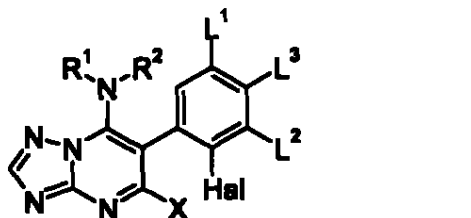
REIVINDICACIONES MODIFICADAS

PARA EFECTUAR

EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



5 en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R^1 , R^2 significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C_1-C_6 ,

halógenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halógenocicloalquilo C_3-C_6 ,

alquenilo C_2-C_6 , halógenoalquenilo C_2-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 ,

10 halógenocicloalquenilo C_3-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halógenoalquinilo C_2-C_6 o

fenilo, naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o

aromático con cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro

heteroátomos del grupo: O, N o S,

15 R^1 y R^2 también pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está ligado por medio de N y pueden contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o contener uno

20 C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , -halógenoalquenilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 ,

halógenoalcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_3-C_6 , halógenoalqueniloxi C_3-C_6 ,

alquilenilo C_1-C_6 y oxi-alquileniloxi C_1-C_6 ;

R¹ y/o R² pueden llevar uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes:

5 **R^a** es halógeno, ciano, nitró, hidróxi, alquilo C₁-C₈, halógenoalquilo C₁-C₈, alquilcarbonilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈, halógenoalcoxi C₁-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquilamino C₁-C₈, di-alquilamino C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, halógenoalquenilo C₂-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, halógenoalqueniloxi C₃-C₈, alquinilo C₂-C₈, halógenoalquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₃-C₈, halógenoalquiniloxi C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, C₃-cicloalquenoxi C₈, oxialquilenoxi C₁-C₈, fenilo, naftilo, heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S, pudiendo estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos por su parte estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a tres grupos R^b:

15 **R^b** es halógeno, ciano, nitró, hidróxi, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, conteniendo los grupos alquilo en estos radicales 1 a 6 átomos de carbono y los grupos alquenilo o alquinilo mencionados en estos radicales 2 a 8 átomos de carbono;

25 y/o uno a tres de los radicales siguientes:

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterociciloxi, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros anulares; arilo, ariloxi, ariltio, aril-alcoxi C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetarilo 5 ó 6 miembros anulares, pudiendo los sistemas cíclicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo;

Hal es halógeno;

10

L¹, L² significan hidrógeno, ciano, alcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆ o C(=O)A, siendo preciso que por lo menos un grupo L¹ o L² no es hidrógeno;

A es hidrógeno, hidroxil alquilo, C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, halógenoalcoxi C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆ o di-(C₁-C₆-alquil)amino;

15

L³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆;

X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halógenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₂.

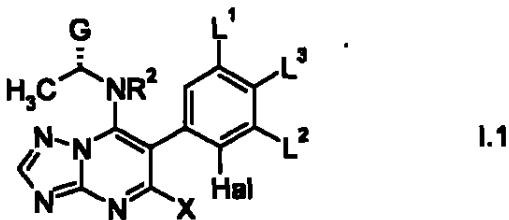
20

2. Compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, donde R¹ no es hidrógeno.

3. Compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, donde R² significa hidrógeno metilo o etilo.

25

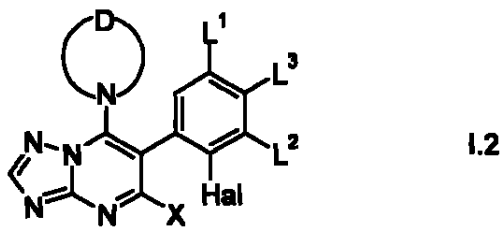
4. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, que corresponden a la fórmula I.1,



en la que

- 5 G significa alquilo C₂-C₆, alcoximetilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;
 R² es hidrógeno o metilo y
 X es cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi y
 L¹ a L³ y Hal tienen las definiciones indicadas para la fórmula 1.

10 5. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, que corresponden a la fórmula I.2,

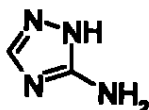


donde

- 15 D forma junto con el átomo de nitrógeno un heterociclilo o heteroarilo de cinco o seis miembros, que está ligado por medio de N y que contiene otro heteroátomo adicional del grupo: O, N y S como miembros anulares, y/o lleva uno o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxí C₁-C₄ y halógenoalquilo C₁-C₂;
- 20 X es cloro, metilo, ciano, metoxi o etoxi y

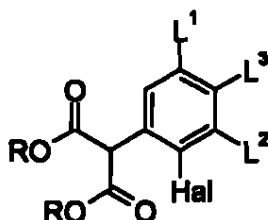
L¹ a L³ y Hal tienen las definiciones indicadas para la fórmula 1.

6. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según la
fórmula 1, en la que X significa halógeno, clano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o
5 halógenoalcoxi C₁-C₂, por reacción de 5-aminotriazol de la fórmula II



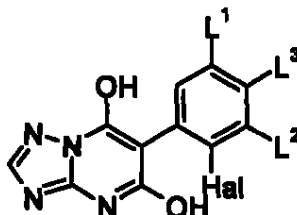
II

con malonatos de fenilo de la fórmula III,



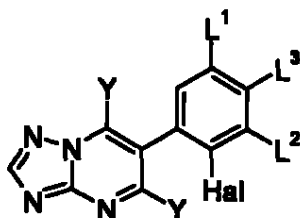
III

- 10 en la que R significa alquilo, en dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV,



IV

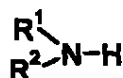
halogenación en compuestos de dihalógeno de la fórmula V,



V

- 15 en la que Y significa halógeno, y transformación de V con aminas de la fórmula

VI



VI

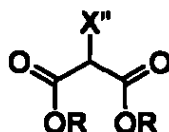
en compuestos de la fórmula I, donde X significa halógeno, en caso de desearlo para la obtención de compuestos I, en los que X significa ciano, alcoxi, C₁-C₄ o halógenoalcoxi C₁-C₂, transformación de compuestos I, en los que X significa halógeno, con compuestos de la fórmula VII,

5



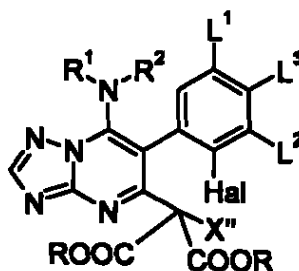
que, dependiendo del grupo X' a incorporar, es un cianuro inorgánico, un alcoxilato o un halógenoalcoxilato y donde M representa un catión amonio, tetraalquilamonio, metal alcalino o metal alcalinotérreo y, en caso de desearlo para la preparación de compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, donde X significa alquilo, por reacción de los compuestos I, en los que X representa halógeno, con malonatos de la fórmula VIII,

10



donde X'' significa hidrógeno o alquilo C₁-C₃ y R significa alquilo C₁-C₄, dando compuestos de la fórmula IX

15

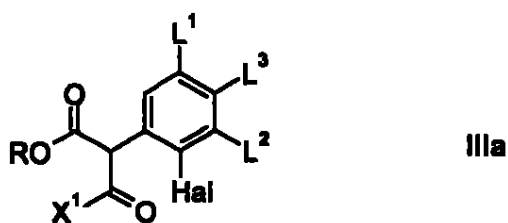


y descarboxilación en compuestos I, en los que X significa alquilo.

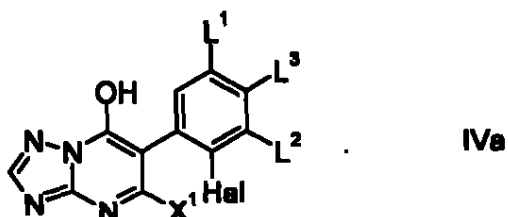
7. Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula I según la fórmula 1, en la que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄, por reacción 5-aminotriazol de la fórmula II según la reivindicación 5 con ceto ésteres de la fórmula IIIa,

20

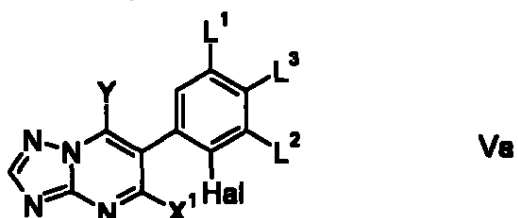
94



en la que X¹ significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄ y R significa alquilo C₁-C₄, en 5-alquil-7-hidroxi-8-feniltriazolopirimidinas de la fórmula IVa,



5 halogenación de IVa en 7-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula Va,



en la que Y significa halógeno y transformación de Va con aminas de la fórmula VI según la reivindicación 5 en compuestos I, en los que X significa alquilo C₁-C₄ o halógenoalquilo C₁-C₄.

10

8. Compuestos de las fórmulas IV, IVa, V y Va según las reivindicaciones 5 y 6.
9. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

15

10. Semillas, que contienen 1 a 1000 g de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1 por 100 kg.

217

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

Religio folio 218
"Extincto"

Expediente No		06059316	No de Folios
Item		No de Unidades	✓
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS: X	1	✓

Observaciones:

un sobre que contiene
arte final.

220
219

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-059316-00000-0000
Fec: 2006-06-15 17:58:24 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tm. 11 PATENTEYII
Eve: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios: 220

MIT : 000174089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 44,158
FECHA : JUNIO 12 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55274900	12/06/2006	24,485,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	463,000.00

SOM: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Glo 00361-891-104-9

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

PATENTE DE INVENCION



MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Descripción de la invención []
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que 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. 2000

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
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio ~~222~~

2020
Bogotá D.C.,

221

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKETIENGESSELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	6 59316
	Solicitud internacional	EP2004/014328
	Fecha inicio fase nacional	18/07/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	971
	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,

51 JUL 2006

ALIX CARMENYA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

adpall