



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

06-88722

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

5-6-DIALQUIL-7-AMINO-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 Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,

Publicacion
Fin 13.11.63

S.S.

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-088722- -00000-0000
Fec: 2008-09-05 17:05:15 Dep. 2020 NUECREACIONES acción
Tra. 11 PATENTE II
Eve: 379 FASE NACIONAL II
Rat 111 PRESENTACION

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL****SOLICITUD DE:****1**☒ Patente de Invención.
☐ Capítulo I.☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☒ 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@camvp.com.**
Domicilio: **Bogotá, Colombia.**

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número **438.019** T.P **31.929**

4**INVENTOR (ES)
(72)**

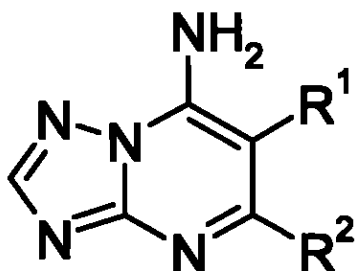
- Jordi TORMO I BLASCO**
Carl-Benz-Strasse. 10-3,
69514 Laudenbach,
República Federal de Alemania
- Carsten BLETNER**
Richard-Wagner-Strasse. 48,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania
- Bernd MÜLLER**
Stockingerstrasse. 7,
67227 Frankenthal,
República Federal de Alemania
- Markus GEWEHR**
Goethestrasse. 21,
56288 Kastellaun,
República Federal de Alemania
- Wassilios GRAMMENOS**
Alexander-Fleming-Strasse. 13,
67071 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania
- Thomas GROTE**
Im Höhnhausen 18,
67157 Wachenheim,
República Federal de Alemania
- Joachim RHEINHEIMER**
Merziger Strasse. 24,
67063 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

- Anja SCHWÖGLER**
Heinrich-Lanz-Strasse. 3,
68165 Mannheim
República Federal de Alemania
- Oliver WAGNER**
Im Meisental 50,
67433 Neustadt
República federal de Alemania
- Matthias NIEDENBRÜCK**
Albert-Einstein-Allee 3,
67117 Limburgerhof
República Federal de Alemania
- Maria SCHERER**
Hermann-Jürgens-Strasse. 30,
76829 Godramstein
República Federal de Alemania
- Siegfried STRATHMANN**
Donnersbergstrasse. 9,
67117 Limburgerhof
República Federal de Alemania
- Ulrich SCHÖFL**
Luftschifftring 22c,
68782 Brühl,
República Federal de Alemania
- Reinhard STIERL**
Jahnstrasse. 8,
67251 Freinsheim,
República Federal de Alemania

	8. Peter SCHÄFER Römerstrasse. 1, 67308 Ottersheim República Federal de Alemania	17. Udo HÜNGER Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz República Federal de Alemania									
	9. Frank SCHIEWECK Lindenweg 4, 67258 Hessheim, República Federal de Alemania										
5	PCT (86) Solicitud Internacional No <u>PCT/EP2005/002424</u> Fecha: <u>8 de marzo de 2005</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2005/087770 A2</u> Fecha: <u>22 de septiembre de 2005</u>										
6	TÍTULO (54) <u>5-6-DIALQUIL-7-AMINO-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN 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 ☐	<table border="1"><thead><tr><th>(33) País de Origen</th><th>(32) Fecha</th><th>(31) Número de Solicitud</th></tr></thead><tbody><tr><td><u>DE</u></td><td><u>10 de marzo de 2004</u></td><td><u>102004012021.8</u></td></tr><tr><td><u>DE</u></td><td><u>10 de marzo de 2004</u></td><td><u>102004012019.8</u></td></tr></tbody></table>	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud	<u>DE</u>	<u>10 de marzo de 2004</u>	<u>102004012021.8</u>	<u>DE</u>	<u>10 de marzo de 2004</u>	<u>102004012019.8</u>
(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud									
<u>DE</u>	<u>10 de marzo de 2004</u>	<u>102004012021.8</u>									
<u>DE</u>	<u>10 de marzo de 2004</u>	<u>102004012019.8</u>									
9	Comprobante de pago No.: <u>06-63.962</u> Fecha: <u>22 de Agosto de 2006</u>										
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes, si fuere el caso. ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud. ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS										

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS1. ☒ **Publicación Internacional**

Descripción:

Páginas 35 en el idioma original

Páginas 50 en español

Reivindicaciones: Número (s) 16

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Traducción de los anexos del Examen Preliminar Internacional sobre patentabilidad**3. ☒ **Extracto de publicación.**

COLOMBIA

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

REPRESENTACION Y PODER

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Yo (nosotros), abajo firmado (s)
BASF Aktiengesellschaft

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)
BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en ..Ludwigshafen, ..República
Federal de Alemania.....

wohnhaft in Ludwigshafen, ..Republica 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.

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

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 fábricas, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y enseññas; 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 oficiosos.

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

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

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

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

JUAN MANUEL BÓTERO MEDINA
NOTARIO


Firma

ppa. Welzel


Unterschrift

ppa. Richters



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

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

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

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

Ludwigshafen am Rhein, den 17. März 1989

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

Thomas W a l t e r

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

Frankenthal (Pfalz). den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)

Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM



Handwritten signature/initials
1. März 1989
H.P. 1

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

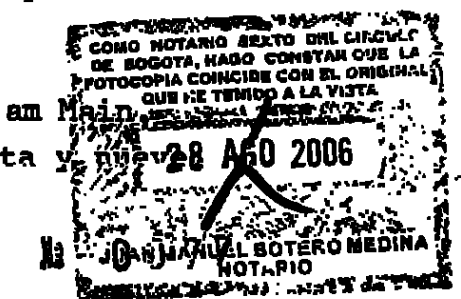
C E R T I F I C A:

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

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

Esta Certificación se expide en Frankfurt am Main,
el seis de Abril de mil novecientos ochenta y nueve
Frankfurt a. M. 06 ABR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE
Por 405.62 de Ley 6.6.44.



Mertha Niño de Staud
Cónsul General de Colombia

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá, 17 de Agosto de 1966 85664

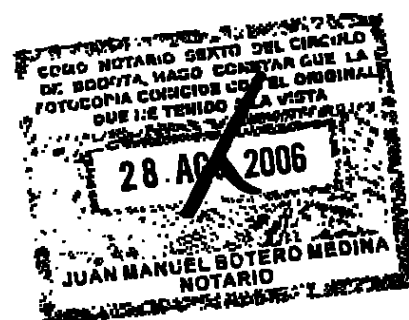
Carla Nina

Manuel

COMO NOTARIO ENTO DEL EJECUTIVO
 EN BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
 FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
 QUE ME TIENGO A LA VISTA

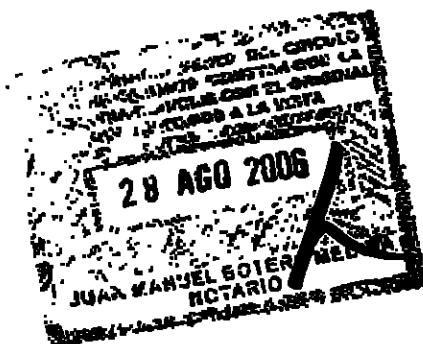
28 AGO 1966

JUAN MANUEL BUITRAGO MELINA
 NOTARIO



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.



LEA LAS INSTRUCCIONES - GENE
RECUERDE QUE TODOS LOS

DE DEBERN ESTAR LLENANDO
CON ALGUN VALOR

LA CERO 00

881051599854

B.C.C. 16
SUCURSAL CORPORATIVA

DECLARACION Y PAGO
IMPUESTO DE
TIMBRACION
NACION

16 013 01 000045 1
RECIBO DE IMPUESTOS
16 013 01 000045 1

1 Administración de Impuestos de: BOGOTA		Código 03	2 Teléfono 2120100
3 Documento de Identificación (marque X) C.C. & T.I. ☐ NIT. ☒ No. 850041367		4 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres). CAVELIER ABOGADOS	
5 Dirección (de la persona o entidad identificada en la cedula 4) Cra. 4a. No. 72-35		6 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres). FORERO ROCHA JAIME	
7 Municipio BOGOTA		8 Departamento CUNDINAMARCA	
9 Número de documentos tributarios.		10	

TIMBRE DE TRADUCCION OFICIAL No. 2058 DE ABRIL 26 DE 1989

PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER

COLO 0361-52-210-8

REVISADO
SECCION DE NEGOCIOS GENERALES
DIRECCION DE ASUNTOS CONSULARES
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

COMO NOTA DEL...
DE BOGOTA HADO...
FOTOCOPIA...
QUE HA TENIDO...
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
BOGOTA

Responsable del pago

Nombre
C.C. No. **19301625**

VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR **750**

VP **750**
VA **0**
IM **0**
IT **0**

1.037

TRADUCCION OFICIAL NO. 2036

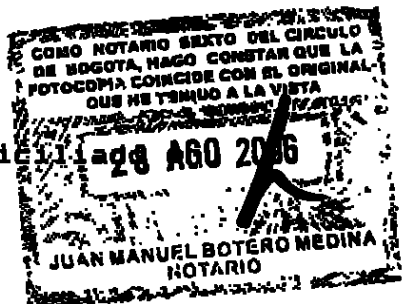
de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

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

Protocolo notarial No. 1407/89

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

1. Dr. Gunther W e 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 ANRAGA DE HERBES
TRADUCCION OFICIAL
Resolución No. 599 Ministerio

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

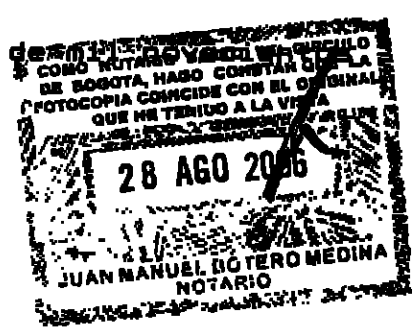
Notario de Ludwigshafen

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 ochenta y nueve



LUZ ARIAGA DE MENDOZA
TRADUCTORA INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. 599 Ministeb

El Presidente del Tribunal Regional

Fdo.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas) El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20,-- DM

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

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Cédula No. 899 Ministerio

28 AGO 2006

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

BOGOTA, 26 DE ABRIL DE 1989

MAIS PUESTA FIDEL

LUZ Arriaga de Herben

IDENTIFICACION C.C. NO. (s)

05 AGO. 1999

SANTAFE DE BOGOTA

LORENDEZ

Ministerio de Relaciones Exteriores
Legislación
Ley No. 11.171
Ley No. 11.172
Ley No. 11.173
Ley No. 11.174
Ley No. 11.175

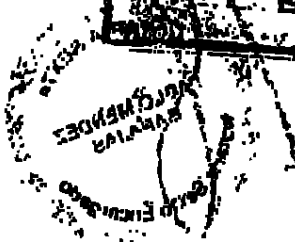
La ley No. 11.171, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.172, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.173, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.174, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.175, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación.

La ley No. 11.171, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.172, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.173, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.174, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación, y la ley No. 11.175, de 1968, sobre el Poder Judicial, es la ley que establece el Poder Judicial de la Federación.

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Legajo No. 8 ABR 1985 No. 89043
HACE CONSTAR
Que el señor LUIZ DE HEER
cuya firma aparece al pie del presente
documento, desempeña en esa fecha
las funciones allí indicadas.

NOTARIO SARTO DEL CIRCULO
DE NOTARIA HAGO CONSTAR QUE LA
FIRMA DEL SEÑOR LUIZ DE HEER
QUE ME PRESENTO A LA VISTA
DE MI LIBRO DE NOTARIA
28 AGO 2006
JUAN MANUEL BOTE OBLUNA
NOTARIO

SECRETARIA DE ASUNTOS GENERALES
División Consular
Encargado



CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª, No. 72-35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

TELEFONO (57) (1) 2128100

CABLES: CAVELEYES

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

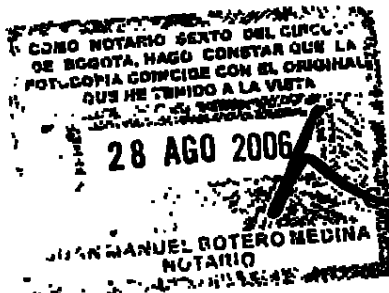
Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, 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

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2262 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá-c.mparecio, el Doctor Emilio F. García

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 929.91
expedida en U/Agu 94 y la tarjeta profesional
número 31.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: R. P. HUARIS (A. P. Huari)
y declaró que la firma que aparece en e. e. uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2262 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá-c.mparecio, el Doctor García

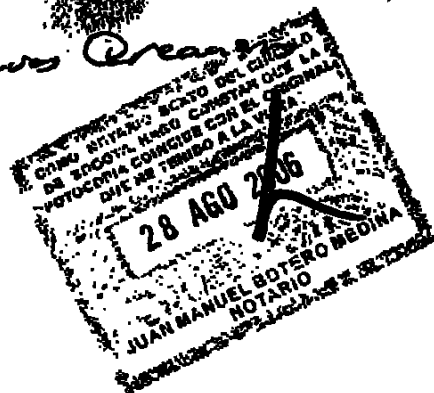
quien exhibió la cédula de ciudadanía n.º 207724
expedida en 26 y la tarjeta profesional
número 677 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Oración
y declaró que la firma que aparece en e. e. uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª Nº. 72-35
BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

Colombia

0000055416

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 Blettner
Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller
Stockinger Str. 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 Höhnhausen 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 Heßheim
Germany
Citizen of Germany
Anja Schwögler
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
Matthias Niedenbrück
Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof
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 Schöff
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
Reinhard Stierl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany
Udo Hüniger
Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz
Germany
Citizen of Germany

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)
inventor(es) de la invención: 5,6-Dialkyl-7-amino-
triazolopyrimidinas, procedimientos para su
preparación y el uso de las mismas
para combatir hongos nocivos, así
como productos que las contienen.

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

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines, their
preparation and their use for controlling harmful fungi, and
compositions comprising these compounds

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

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

BASF Aktiengesellschaft

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Alamania

Germany

domiciliada en

domiciled in

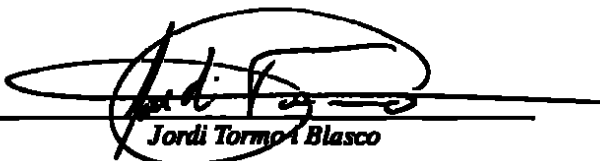
67056 Ludwigshafen, Alamania

67056 Ludwigshafen, Germany

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

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

Dado y firmado hoy Given and signed this 24. Feb. 2005
Firma Signature


Jordi Tormo Blasco


Carsten Blettner


Bernd Müller


Markus Geyher


Wassilios Grammenos

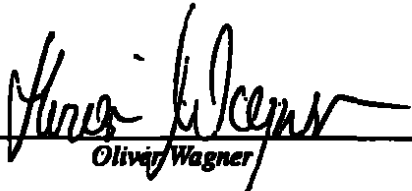

Thomas Grote


Joachim Rheinheimer

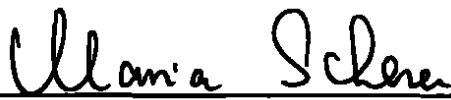

Peter Schäfer


Frank Schieweck


Anja Schwögl


Oliver Wagner


Matthias Niedenbrück


Maria Scherer


Siegfried Strathmann


Ulrich Schöfl


Reinhard Stierl


Udo Hüniger

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WFFODERE-343

CO Assignment Form 01 11/08

U.R.Nr. 424/2005

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 **Torno i Blasco**, residing at Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Germany, Citizen of Spain, personally known to me,
2. Mr. Carsten **Blettner**, residing at Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
3. Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
4. Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, Citizen of Greece, 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 Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
8. Mr. Peter **Schäfer**, residing at Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Germany, personally known to me,
9. Mr. 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. Mr. Matthias **Niedenbrück**, residing at Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof, Germany, personally known to me,

13. Mrs. Maria **Scherer**, residing at Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Godramstein, Germany, personally known to me,
14. Mr. Siegfried **Strathmann**, residing at Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Germany, personally known to me,
15. Mr. Ulrich **Schöfl**, residing at Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Germany, personally known to me,
16. Mr. Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Germany, personally known to me.
17. Mr. Udo **Hünger**, residing at Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz, Germany, personally known to me.

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 24th day of February, 2005

Notar

Wert: 5.112,92 Euro

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. Ist unterschrieben von Notar
D r a x e l - F i s c h e r
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 3. März 2005
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 309-317/05

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



.....
(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

TRADUCCION OFICIAL No. 11540

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

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

Jordi Torno 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 Frantkenthal, 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 ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

2

Oliver Wagner
 Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania
 Ciudadano de Alemania
 Matthias Niedenbrück
 Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof, 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,
 Udo Hüniger
 Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz, Alemania,

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

5-6 dialquil-7-amino-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 diecisiete firmas ilegibles de los mencionados señores. Dado y firmado el 24 de febrero de 2005.

Sigue: Autenticación notarial en inglés de las diecisiete firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 24 de febrero de 2005, bajo U.R. No. 424/2005. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros

LIZ ABRIAGA DE HERBEN
 TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

 Resolución No.599 Minjusticia

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer

3. Actuando en calidad de notario público

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

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES
3364
CADA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO OTSSEMENA
LAS FIRMAS APARECEN EN EL

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)

6. el 3 de marzo de 2005

7. por el Presidente del Tribunal Regional

8. bajo el No. 91 Eb – 309-317/05

9. Sello

(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma

Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)

Juez del Tribunal Regional

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
AUG 22 P 2:21
JEFE DE LEGALIZACIONES
SIN AFECTAR PRECATORIO

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, 19 de agosto de 2008

c. 3018

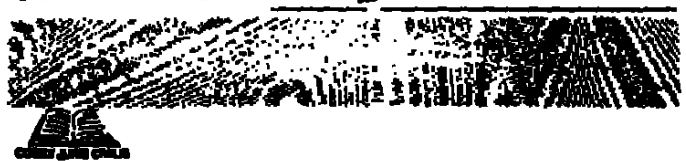
LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No.599 Minjusticia

CONF. NOTARIO SEXTO DEL CÍRCULO DE SANTAFÉ DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE

dey Arriaga de Herber

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL (ELLOS) EN ESTA NOTARÍA

SANTAFÉ DE BOGOTÁ. 22 AGO 2006



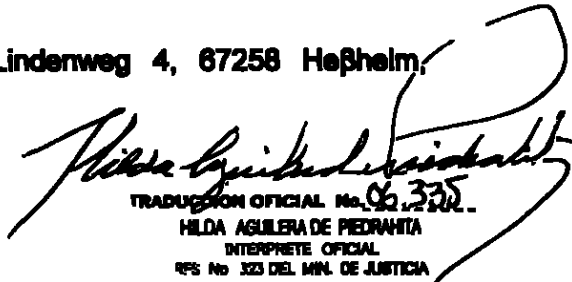
Traducción Oficial No. 06.335 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del traductor al tiempo con la presente. Esta traducción ha sido preparada por Hilda Aguilera de Piedrahita, traductora oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y autorizada por el Ministerio de Justicia y del Derecho por Resolución No. 323 de 1980.

(Se traduce del Inglés la Certificación Notarial de un Documento de Cesión que se encuentra escrito en Inglés y Español cuya Apostilla No. 91Eb-309-31705 se encuentra en Alemán)

U.R.Nr. 424/2005

Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público en Ludwigs-hafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente testifico y confirmo que las firmas anteriores de

1. El Sr. Jordi Tormo i Blasco, residente en Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania, Ciudadano de España, a quien conozco personalmente,
2. El Sr. Carsten Blettner, residente en Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Alemania, a quien conozco personalmente,
3. El Sr. Bernd Müller, residente en Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, Alemania, a quien conozco personalmente,
4. El Sr. Markus Gewehr, residente en Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Alemania, a quien conozco personalmente,
5. El Sr. Wassilios Grammenos, residente en Alexander-Fleming Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, a quien conozco personalmente,
6. El Sr. Thomas Grote, residente en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, a quien conozco personalmente,
7. El Sr. Joachim Rheinheimer, residente en Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, a quien conozco personalmente,
8. El Sr. Peter Schäfer, residente en Romerstr. 1, 67308 Ottersheim, Alemania, a quien conozco personalmente,
9. El Sr. Frank Schieweck, residente en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania, a quien conozco personalmente,


TRADUCCION OFICIAL No. 06.335
HILDA AGUILERA DE PIEDRAHITA
INTERPRETE OFICIAL
RFS No. 323 DEL MIN. DE JUSTICIA

10. La Sra. Anja Schwölger, residente en Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania, a quien conozco personalmente,
11. El Sr. Oliver Wagner, residente en Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania, a quien conozco personalmente,
12. El Sr. Mathias Niedenbrück, residente en Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Linburgerhof, Alemania, a quien conozco personalmente,
13. La Sra. Maria Scherer, residente en Herman-Jurgens-Str. 30, 76829, Godramstein, Alemania, a quien conozco personalmente,
14. El Sr. Siegfried Stathmann, residente en Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, a quien conozco personalmente,
15. El Sr. Ulrich Schöff, residente en Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania, a quien conozco personalmente,
16. El Sr. Reinhard Stierl, residente en Jahnstr. 8, 67227 Freinsheim, Alemania, a quien conozco personalmente,
17. El Sr. Udo Hüniger, residente en Kurt-Schumacher-Str. 5124, Mainz, Alemania, a quien conozco personalmente,

Son fieles y válidas.

Ludwigshafen/Rhine, este día 24 de Febrero de 2005.

(Firmado)

Noatario

Wert: 5.112,92 Euro

Apostilla en Alemán No. 91Eb-309-317/05 de fecha Marzo 3, 2005.

ES TRADUCCIÓN FIEL Y COMPLETA de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su confrontación y a la cual me remito.

Bogotá, Agosto 16 de 2006.

Caracteres 2.716 Colo: 361-841-130-4

[Firma]
 TRADUCCIÓN OFICIAL No. 06.335
 HILDA AGUILERA DE PIEDRAHITA
 INTERPRETE OFICIAL
 RES. No. 323 DEL MIN. DE JUSTICIA

MINISTERIO DE RELACIONES
 EXTERIORES
 3 JUL 2005
 CUYA FORMA APARECE EN EL
 DOCUMENTO NO. 91Eb-309-317/05
 LAS FIRMAS DE LOS ABOGADOS
 JEFE DE LEGALIZACIONES
 2006 AGR 12 P 2: 34
 RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
 ABISASUME

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
22. September 2005 (22.09.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/087770 A2(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 487/04

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/002424

(22) Internationales Anmeldedatum:
8. März 2005 (08.03.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

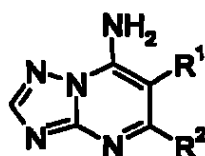
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102004012021.8 10. März 2004 (10.03.2004) DE
102004012019.6 10. März 2004 (10.03.2004) DE(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BASF Aktiengesellschaft [DE/DE]; 67056
Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO,
Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach
(DE). BLETTER, 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, Wendelin [GR/DE];
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).
GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhenhausen 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 Meisental 50, 67433 Neustadt (DE).
NIEDENBRÜCK, Matthias [DE/DE]; Albert-Rin-
stein-Allee 3, 67117 Limburgerhof (DE). SCHERER,Marin [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Go-
drumstein (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE];
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL,
Ulrich [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl (DE). STIERL,
Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251 Freinsheim (DE).
HÜNGER, Udo [DE/DE]; Kurt-Schumacher-Str. 43,
55124 Mainz (DE).(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF Aktiengesellschaft;
67056 Ludwigshafen (DE).(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-
öffentlichen nach Erhalt des BerichtsZur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.(54) Title: 5,6-DIALKYL-7-AMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION, THEIR USE FOR
CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS(54) Bezeichnung: 5,6-DIALKYL-7-AMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND
IHRER VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL(57) Abstract: The invention relates to 5,6-dialkyl-7-amino-triazolopyrimidines of for-
mula (I), in which the substituents are defined as follows: R¹ represents alkyl, alkoxyalkyl,
alkenyl or alkynyl; R² represents alkyl, alkoxyalkyl, alkenyl or alkynyl, R¹ and/or R² be-
ing substituted according to the description. The invention also relates to a method for
producing said compounds, to agents containing the latter and to their use for controlling
plant-pathogenic fungi.(57) Zusammenfassung: 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel I in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:
R¹ Alkyl, Alkoxyalkyl, Alkenyl oder Alkynyl; R² Alkyl, Alkoxyalkyl, Alkenyl oder Alkynyl; wobei R¹ und/oder R² gemäß der
Beschreibung substituiert sind; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur
Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

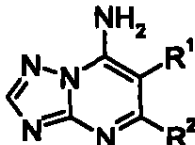
WO 2005/087770 A2

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines, their preparation and their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising these compounds

Description

5

The present invention relates to 5,6-dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are as defined below:

10

R¹ is C₂-C₁₂-alkenyl or C₂-C₁₂-alkynyl, where the carbon chains are unsubstituted or carry one to three identical or different groups R^a and/or R^b;

or

15

C₁-C₁₄-alkyl, C₁-C₁₂-alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₁₂-alkenyl or C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₁₂-alkynyl, where the carbon chains carry one to three identical or different groups R^a;

20

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₈-alkylthio, C₃-C₁₂-alkenyloxy, C₃-C₁₂-alkynyloxy, NR¹¹R¹², or

C₃-C₈-cycloalkyl which may carry one to four identical or different groups R^b;

25

R^b is C₁-C₄-alkyl, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-alkylthio, C₃-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-alkynyloxy and NR¹¹R¹²

R¹¹, R¹² are hydrogen or C₁-C₈-Alkyl;

30

where the carbon chains of the groups R^a for their part may be halogenated;

35

R² is C₁-C₁₂-alkyl, C₂-C₁₂-alkenyl or C₂-C₁₂-alkynyl, where the carbon chains may be substituted by one to three groups R^c:

R^c is cyano, nitro, hydroxyl, NR¹¹R¹²; or C₃-C₈-cycloalkyl which may carry one to four identical or different groups C₁-C₄-alkyl, halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-alkylthio, C₃-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-alkynyloxy

or $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$.

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

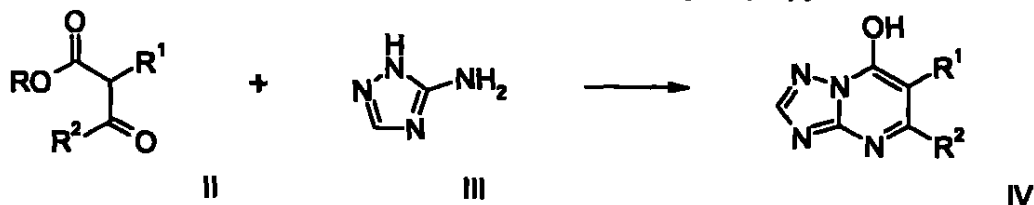
5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines are proposed in a general manner in GB 1 148 629. Individual fungicidally active 5,6-dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines are known from EP-A 141 317. However, in many cases their activity is unsatisfactory. Based on this, it is an object of the present invention to provide compounds having improved activity and/or a wider activity spectrum.

We have found that this object is achieved by the definitions 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 of the formula I differ from those in the abovementioned publications by the specific embodiment of the substituent in the 6-position of the triazolopyrimidine skeleton, which is a haloalkyl group or an unsaturated aliphatic group.

Compared to the known compounds, the compounds of the formula I are more effective against harmful fungi.

The compounds according to the invention can be obtained by different routes. Advantageously, the compounds according to the invention are obtained by converting substituted β -ketoesters of the formula II with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula IV. The groups R^1 and R^2 in formulae II and IV are as defined for formula I and the group R in formula II is C_1 - C_4 -alkyl; for practical reasons, preference is given here to methyl, ethyl or propyl.

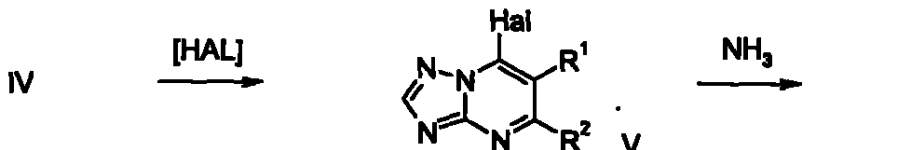


The reaction of the substituted β -ketoesters of the formula II with the aminoazoles of the formula III can be carried out in the presence or absence of solvents. It is advantageous to use solvents to which the starting materials are substantially inert and in which they are completely or partially soluble. Suitable solvents are in particular alcohols, such as ethanol, propanols, butanols, glycols or glycol monoethers, diethylene glycols or their monoethers, aromatic hydrocarbons, such as toluene, benzene or mesitylene, amides, such as dimethylformamide, diethylformamide,

3

dibutylformamide, N,N-dimethylacetamide, lower alkanolic acids, such as formic acid, acetic acid, propionic acid, or bases, such as alkali metal and alkaline earth metal hydroxides, alkali metal and alkaline earth metal oxides, alkali metal and alkaline earth metal hydrides, alkali metal amides, alkali metal and alkaline earth metal carbonates and also alkali metal bicarbonates, organometallic compounds, in particular alkali metal alkyls, alkylmagnesium halides and also alkali metal and alkaline earth metal alkoxides and dimethoxymagnesium, moreover organic bases, for example tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, trisopropylethylamine, tributylamine and N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, pyridine, substituted pyridines, such as collidine, lutidine and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic amines and mixtures of these solvents with water. Suitable catalysts are bases, such as those mentioned above, or acids, such as sulfonic acids or mineral acids. With particular preference, the reaction is carried out in the absence of a solvent or in chlorobenzene, xylene, dimethyl sulfoxide or N-methylpyrrolidone. Particularly preferred bases are tertiary amines, such as trisopropylamine, tributylamine, N-methylmorpholine or N-methylpiperidine. The temperatures are from 50 to 300°C, preferably from 50 to 180°C, if the reaction is carried out in solution [cf. EP-A 770 615; Adv. Het. Chem. 57 (1993), 81ff].

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

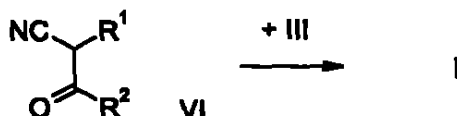


In most cases, the resulting condensates of the formula IV precipitate from the reaction solutions in pure form and, after washing with the same solvent or with water and subsequent drying they are reacted with halogenating agents, in particular chlorinating or brominating agents, to give the compounds of the formula V in which Hal is chlorine or bromine, in particular chlorine. The reaction is preferably carried out using chlorinating agents such as phosphorus oxychloride, thionyl chloride or sulfonyl chloride at from 50°C to 150°C, preferably in excess phosphorus oxytrichloride at reflux temperature. After evaporation of excess phosphorus oxytrichloride, the residue is treated with ice-water, if appropriate with addition of a water-immiscible solvent. In most cases, the chlorinated product isolated from the dried organic phase, if appropriate after evaporation of the inert solvent, is very pure and is subsequently reacted with ammonia in inert solvents at from 100°C to 200°C to give the 7-amino-triazolo[1,5-a]pyrimidines. This reaction is preferably carried out using a 1- to 10-molar excess of ammonia, under a pressure of from 1 to 100 bar.

The novel 7-aminoazolo[1,5-a]pyrimidines are, if appropriate after evaporation of the solvent, isolated as crystalline compounds, by digestion in water.

The β -ketoesters of the formula II can be prepared as described in Organic Synthesis Coll. Vol. 1, p. 248, and/or they are commercially available.

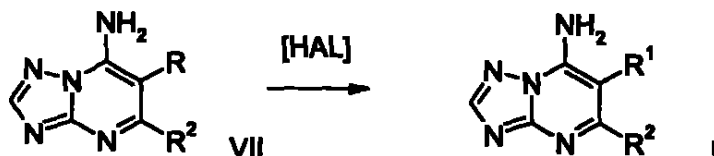
- Alternatively, the novel compounds of the formula I can be obtained by reacting substituted acyl cyanides of the formula VI in which R^1 and R^2 are as defined above with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III.



- The reaction can be carried out in the presence or absence of solvents. It is advantageous to use solvents to which the starting materials are substantially inert and in which they are completely or partially soluble. Suitable solvents are in particular alcohols, such as ethanol, propanols, butanols, glycols or glycol monoethers, diethylene glycols or their monoethers, aromatic hydrocarbons, such as toluene, benzene or mesitylene, amides, such as dimethylformamide, diethylformamide, dibutylformamide, N,N-dimethylacetamide, lower alkanolic acids, such as formic acid, acetic acid, propionic acid, or bases, such as those mentioned above, and mixtures of these solvents with water. The reaction temperatures are from 50 to 300°C, preferably from 50 to 150°C, if the reaction is carried out in solution.

- Some of the substituted alkyl cyanides of the formula VI required for preparing the 7-aminoazolo[1,5-a]pyrimidines are known, or they can be prepared by known methods from alkyl cyanides and carboxylic acid esters using strong bases, for example alkali metal hydrides, alkali metal alcoholates, alkali metal amides or metal alkyls (cf.: J. Amer. Chem. Soc. 73, (1951), p. 3766).

- Compounds of the formula I in which R^1 is C_1 - C_{14} -haloalkyl, C_1 - C_{12} -haloalkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl or C_2 - C_{12} -haloalkynyl can be obtained advantageously by halogenating corresponding triazolopyrimidines of the formula VII:



- In the formula VII, R is C_1 - C_{14} -alkyl, C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, where the carbon chains may carry one to three groups R^a .

- The halogenation is usually carried out at temperatures of from 0°C to 200°C, preferably from 20°C to 110°C, in an inert organic solvent in the presence of a free-radical initiator (for example dibenzoyl peroxide or azobisisobutyronitrile or under UV irradiation, for example with an Hg vapor lamp) or an acid [cf. Synthetic Reagents, volume 2, pp. 1-63, Wiley, New York (1974)].

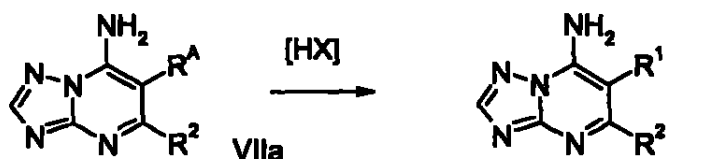
The reaction partners are generally reacted with one another in equimolar amounts. In terms of yield, it may be advantageous to employ an excess of halogenating agent, based on VII.

5

Suitable halogenating agents are, for example, elemental halogens (for example Cl_2 , Br_2 , I_2), N-bromosuccinimide, N-chlorosuccinimide or dibromodimethylhydrantoin. The halogenating agents are generally employed in equimolar amounts, in excess or, if appropriate, as solvent.

10

Alternatively, compounds of the formula I, in which R^1 is C_1 - C_{14} -haloalkyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl or C_2 - C_{12} -haloalkynyl can be obtained by ether cleavage of corresponding triazolopyrimidines of the formula VIIa:



- 15 In the formula VIIa, R^A is C_1 - C_{14} -alkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl or C_2 - C_{12} -alkynyl, where the groups R^A are substituted by hydroxyl or alkoxy carbonyl groups. By heating the compounds VIIa in the presence of mineral acids [HX], such as hydrochloric acid or hydrobromic acid, or nitric acid, the compounds I are obtained [cf. Organikum, 15th edition, p. 237 ff., VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1981].

20

Some of the triazolopyrimidines of the formulae VII and VIIa required for preparing the compounds I described above are known, or they can be prepared by known methods [cf. EP-A 141 317].

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

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

30

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

halogen: fluorine, chlorine, bromine and iodine in particular fluorine or chlorine;

alkyl: saturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 1 to 4, 6, 8 or

10 carbon atoms, for example C₁-C₈-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,
 5 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
 10 (as mentioned above), where some or all of the hydrogen atoms in these groups may be replaced by halogen atoms as mentioned above: in particular C₁-C₂-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, 8
 20 or 10 carbon atoms and one or two double bonds in any position, for example C₂-C₈-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,
 25 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,
 30 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;

alkoxyalkyl: a saturated straight-chain or mono-, di- or tribranched hydrocarbon chain
 40 which is interrupted by an oxygen atom, for example C₅-C₁₂-alkoxyalkyl: a hydrocarbon chain as described above having 5 to 12 carbon atoms which may be interrupted by an oxygen in any position, such as propoxyethyl, butoxyethyl, pentoxyethyl, hexyloxyethyl,

heptyloxyethyl, octyloxyethyl, nonyloxyethyl, 3-(3-ethylhexyloxy)ethyl, 3-(2,4,4-trimethylpentyloxy)ethyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)ethyl, ethoxypropyl, propoxypropyl, butoxypropyl, pentoxypropyl, hexyloxypropyl, heptyloxypropyl, octyloxypropyl, nonyloxypropyl, 3-(3-ethylhexyloxy)propyl, 3-(2,4,4-trimethylpentyloxy)propyl,
 5 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)propyl, ethoxybutyl, propoxybutyl, butoxybutyl, pentoxybutyl, hexyloxybutyl, heptyloxybutyl, octyloxybutyl, nonyloxybutyl, 3-(3-ethylhexyloxy)butyl, 3-(2,4,4-trimethylpentyloxy)butyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)butyl, methoxypentyl, ethoxypentyl, propoxypentyl, butoxypentyl, pentoxy-pentyl, hexyloxy-pentyl, heptyloxy-pentyl, 3-(3-methylhexyloxy)pentyl, 3-(2,4-dimethylpentyloxy)pentyl, 3-(1-ethyl-3-
 10 methylbutoxy)pentyl;

haloalkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 10 carbon atoms and one or two double bonds in any position (as mentioned above), where some or all of the hydrogen atoms in these groups may be replaced by halogen
 15 atoms as mentioned above, in particular by fluorine, chlorine and bromine;

alkynyl: straight-chain or branched hydrocarbon groups having 2 to 4, 6, 8 or 10 carbon atoms and one or two triple bonds in any position, for example C₂-C₈-alkynyl such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butynyl, 2-butynyl, 3-butynyl, 1-methyl-2-propynyl, 1-
 20 pentynyl, 2-pentynyl, 3-pentynyl, 4-pentynyl, 1-methyl-2-butynyl, 1-methyl-3-butynyl, 2-methyl-3-butynyl, 3-methyl-1-butynyl, 1,1-dimethyl-2-propynyl, 1-ethyl-2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-methyl-2-pentynyl, 1-methyl-3-pentynyl, 1-methyl-4-pentynyl, 2-methyl-3-pentynyl, 2-methyl-4-pentynyl, 3-methyl-1-pentynyl, 3-methyl-4-pentynyl, 4-methyl-1-pentynyl, 4-methyl-2-pentynyl, 1,1-dimethyl-
 25 2-butynyl, 1,1-dimethyl-3-butynyl, 1,2-dimethyl-3-butynyl, 2,2-dimethyl-3-butynyl, 3,3-dimethyl-1-butynyl, 1-ethyl-2-butynyl, 1-ethyl-3-butynyl, 2-ethyl-3-butynyl and 1-ethyl-1-methyl-2-propynyl;

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

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

35 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:

Preference is given to compounds I in which the group R¹ has at most 9 carbon atoms.
 40

Likewise, preference is given to compounds of the formula I in which R¹ is a straight-chain or mono-, di-, tri- or polybranched haloalkyl group.

If R¹ is haloalkyl, the halogenation is preferably at the terminal carbon. Preference is given to monohaloalkyl groups.

5 In one embodiment of the compounds I according to the invention, R¹ is C₁-C₁₄-haloalkyl, C₁-C₁₂-haloalkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-alkoxy-C₁-C₁₂-haloalkyl, C₂-C₁₂-haloalkenyl or C₂-C₁₂-haloalkynyl, the groups having one or two halogen atoms. C₁-C₈-haloalkoxypropyl and C₁-C₈-alkoxyhalopropyl groups are preferred here.

10 In another embodiment of the compounds I, R¹ is a group C₁-C₁₄-haloalkyl, C₁-C₁₂-haloalkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-alkoxy-C₁-C₁₂-haloalkyl, C₂-C₁₂-haloalkenyl or C₂-C₁₂-haloalkynyl, which groups contain a halogen atom at the α carbon atom.

In addition, preference is given to compounds of the formula I in which R¹ is a group
15 (CH₂)_nCH₂Cl, (CH₂)_nCH₂Br, CH(CH₃)(CH₂)_mCH₂Cl, CH(CH₃)(CH₂)_mCH₂Br, (CH₂)_nCF₃ or CH(CH₃)(CH₂)_mCF₃, where n is a number from 0 to 13 and m is a number from 0 to 11.

Particular preference is given to compounds I in which R¹ is chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl,
20 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, 1,1,1-trifluoroprop-2-yl, 1-chloropropyl, 1-fluoropropyl, 3-chloropropyl, 3-fluoropropyl, 3,3,3-trifluoropropyl, 1-chlorobutyl, 1-
25 fluorobutyl, 4-chlorobutyl, 4-fluorobutyl, 4,4,4-trifluorobutyl, 1-chloropentyl, 1-fluoropentyl, 5,5,5-trifluoropentyl, 5-chloropentyl, 5-fluoropentyl, 1-chlorohexyl, 1-fluorohexyl, 6-chlorohexyl, 6-fluorohexyl, 6,6,6-trifluorohexyl, 1-chloroheptyl, 1-fluoroheptyl, 7-chloroheptyl, 7-fluoroheptyl, 7,7,7-trifluoroheptyl, 1-chlorooctyl, 1-fluorooctyl, 8-fluorooctyl, 8,8,8-trifluorooctyl, 1-chlorononyl, 1-fluorononyl, 9-fluorononyl, 9,9,9-
30 trifluorononyl, 9-chlorononyl, 1-fluorodecyl, 1-chlorodecyl, 10-fluorodecyl, 10,10,10-trifluorodecyl, 10-chlorodecyl, 1-chloroundecyl, 1-fluoroundecyl, 11-chloroundecyl, 11-fluoroundecyl, 11,11,11-trifluoroundecyl, 1-chlorododecyl, 1-fluorododecyl, 12-chlorododecyl, 12-fluorododecyl or 12,12,12-trifluorododecyl.

35 In a further embodiment of the compounds I, R¹ is C₂-C₁₂-alkenyl or C₂-C₁₂-alkynyl, where the hydrocarbon chains are unsubstituted or carry one to three identical or different groups R^a and/or R^b.

In a preferred embodiment of the compounds of the formula I the group R^a is absent.

40 Particular preference is given to compounds I in which the carbon chains of R¹ and R² together do not have more than 14 carbon atoms.

In one embodiment of the compounds I according to the invention, R² is methyl, ethyl, isopropyl, n-propyl or n-butyl, preferably methyl, ethyl, isopropyl or n-propyl, in particular methyl or ethyl.

5

Halogen atoms in the groups R¹ are preferably located at the α or Ω carbon atom.

Cyano groups in R¹ and/or R² are preferably located at the terminal carbon atom.

10 In a further preferred embodiment of the compounds of the formula I the group R^b is absent.

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
15 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 R¹ for each compound corresponds to one row of
20 Table A and R² is methyl

Table 2
Compounds of the formula I in which R¹ for each compound corresponds to one row of
Table A and R² is ethyl
25

Table 3
Compounds of the formula I in which R¹ for each compound corresponds to one row of
Table A and R² is n-propyl

30 Table 4
Compounds of the formula I in which R¹ for each compound corresponds to one row of
Table A and R² is isopropyl

Table 5
35 Compounds of the formula I in which R¹ for each compound corresponds to one row of
Table A and R² is n-butyl

Table A

No.	R ¹
A-1	CH ₂ F
A-2	CH ₂ Cl

10

No.	R ¹
A-3	CH ₂ Br
A-4	CHF ₂
A-5	CHCl ₂
A-6	CF ₃
A-7	CCl ₃
A-8	CHFCH ₃
A-9	CHClCH ₃
A-10	CH ₂ CH ₂ F
A-11	CH ₂ CH ₂ Cl
A-12	CH ₂ CH ₂ Br
A-13	CCl ₂ CH ₃
A-14	CF ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CHF ₂
A-16	CH ₂ CHCl ₂
A-17	CH ₂ CF ₃
A-18	CH ₂ CCl ₃
A-19	CF ₂ CF ₃
A-20	CCl ₂ CCl ₃
A-21	CHFCH ₂ CH ₃
A-22	CHClCH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ CHFCH ₃
A-24	CH ₂ CHClCH ₃
A-25	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-26	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-27	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-28	CCl ₂ CH ₂ CH ₃
A-29	CF ₂ CH ₂ CH ₃
A-30	CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-31	CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-32	CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-33	CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-34	CF ₂ CF ₂ CF ₃

11

No.	R ¹
A-35	$\text{CCl}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$
A-36	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$
A-37	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{F}$
A-38	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Cl}$
A-39	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Br}$
A-40	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CHF}_2$
A-41	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CHCl}_2$
A-42	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{F})_2$
A-43	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{Cl})_2$
A-44	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{Br})_2$
A-45	$\text{CH}(\text{CHF}_2)_2$
A-46	$\text{CH}(\text{CHCl}_2)_2$
A-47	$\text{CHFCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-48	$\text{CHClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-49	$\text{CH}_2\text{CHFCH}_2\text{CH}_3$
A-50	$\text{CH}_2\text{CHClCH}_2\text{CH}_3$
A-51	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHFCH}_3$
A-52	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHClCH}_3$
A-53	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$
A-54	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
A-55	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$
A-56	$\text{CCl}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-57	$\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-58	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHF}_2$
A-59	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHCl}_2$
A-60	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$
A-61	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$
A-62	$\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$
A-63	$\text{CCl}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$
A-64	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$
A-65	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
A-66	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$

12

No.	R ¹
A-67	CH(CH ₃)CH ₂ CF ₃
A-68	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-69	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-71	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-72	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-74	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-75	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-76	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-77	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-78	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-79	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-80	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-81	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-82	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-83	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-84	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-85	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-86	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-87	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-88	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-89	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-90	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-91	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-92	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-93	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-94	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-95	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-96	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-97	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-98	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃

[illegible]

No.	R ¹
A-227	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$
A-228	$\text{CH}=\text{CH}_2$
A-229	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-230	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-231	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$
A-232	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-233	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-234	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-235	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$
A-236	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-237	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-238	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-239	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-240	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-241	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-242	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-243	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-244	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-245	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-246	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-247	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-248	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-249	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-250	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-251	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-252	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-253	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-254	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-255	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-256	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-257	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-258	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

No.	R ¹
A-259	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-260	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-261	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-262	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-263	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-264	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-265	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-266	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-267	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-268	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-269	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-270	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-271	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-272	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-273	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-274	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-275	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-276	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-277	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-278	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-279	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-280	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-281	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-282	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-283	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-284	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-285	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-286	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-287	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-288	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-289	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-290	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

No.	R ¹
A-291	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-292	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-293	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-294	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-295	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-296	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-297	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-298	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-299	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-300	$\text{C}\equiv\text{CH}$
A-301	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-302	$\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-303	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-304	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-305	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-306	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}\equiv\text{CH}$
A-307	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-308	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-309	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-310	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-311	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-312	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-313	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-314	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-315	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-316	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-317	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-318	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-319	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-320	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-321	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-322	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

No.	R ¹
A-355	$C \equiv CCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-356	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2C \equiv CH$
A-357	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2C \equiv CCH_3$
A-358	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CN$
A-359	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CN$
A-360	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CN$
A-361	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-362	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-363	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CN$
A-364	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CN$
A-365	$CH_2C(CH_3)_2CH_2CN$
A-366	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CN$
A-367	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CN$
A-368	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CN$
A-369	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CN$
A-370	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2CH_2CH_2CN$
A-371	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-372	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CN$
A-373	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-374	$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CN$
A-375	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-376	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CN$
A-377	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CN$
A-378	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CN$
A-379	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CN$
A-380	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CN$
A-381	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-382	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CN$
A-383	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CN$
A-384	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CN$
A-385	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CN$
A-386	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CN$

No.	R ¹
A-419	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-420	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-421	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-422	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-423	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-424	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-425	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-426	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-427	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-428	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-429	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-430	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-431	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-432	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-433	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-434	CH(CH ₃)CH ₂ OHCH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-435	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-436	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-437	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃)CH ₂ CN
A-438	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-439	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-440	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-441	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-442	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-443	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-444	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-445	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-446	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-447	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-448	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-449	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-450	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN

No.	R ¹
A-451	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-452	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-453	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-454	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-455	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-456	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-457	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-458	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-459	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-460	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-461	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-462	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-463	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-464	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-465	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-466	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-467	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-468	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-469	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-470	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-471	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-472	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-473	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-474	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-475	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-476	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-477	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-478	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-479	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-480	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-481	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-482	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN

[illegible]

No.	R ¹
A-515	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-516	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-517	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-518	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-519	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-520	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-521	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-522	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN

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*, in particular from the class of the *Oomycetes*. Some are systemically effective and they can be used in plant protection as foliar fungicides, as fungicides for seed dressing 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, corn, 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.

- 15 They are especially suitable for controlling the following plant diseases:
- *Alternaria* species on fruit and vegetables,
 - *Bipolaris* and *Drechslera* species on cereals, rice and lawns,
 - *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
 - *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamental plants and
 - 20 grapevines,
 - *Bremia lactucae* on lettuce,
 - *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
 - *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
 - *Mycosphaerella* species on cereals, bananas and peanuts,
 - 25 • *Peronospora* species on cabbage and bulbous plants,
 - *Phakopsora pachyrhizi* and *P. meibomia* on soybeans
 - *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
 - *Phytophthora capsici* on peppers,
 - *Plasmopara viticola* on grapevines,
 - 30 • *Podosphaera leucotricha* on apples,

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

They are particularly suitable for controlling harmful fungi from the class of the *Oomycetes*, such as *Peronospora* species, *Phytophthora* species, *Plasmopara viticola* and *Pseudoperonospora* species.

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, preferably 5 to 100 g/100 kg of seed are generally required.

35

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

40

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.

5 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
10 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
15 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,
20 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,
25 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.

30 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,
35 tetrahydronaphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol, ethanol, propanol, butanol, cyclohexanol, cyclohexanone, isophorone, strongly polar solvents, for example dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone and water.

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

Granules, for example coated granules, impregnated granules and homogeneous

granules, can be prepared by binding the active compounds to solid carriers. Examples of solid carriers are mineral earths such as silica gels, silicates, talc, kaolin, attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate, magnesium sulfate, magnesium oxide, ground synthetic materials, fertilizers, such as, 5 for example, ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, ureas, and products of vegetable origin, such as cereal meal, tree bark meal, wood meal and nutshell meal, cellulose powders and other solid carriers.

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

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

15 A Water-soluble concentrates (SL)

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

20 B Dispersible concentrates (DC)

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

25 C Emulsifiable concentrates (EC)

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

30 D Emulsions (EW, EO)

40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5%). This mixture is introduced into water by means of an emulsifying machine (Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an 35 emulsion.

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 40 give a fine active compound suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound.

30

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.

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.

2. Products to be applied undiluted**15 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)

20 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.

J ULV solutions (UL)

25 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.

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 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.

40 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.

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%.

5

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.

- 10 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.

- 15 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
20 being obtained.

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

25

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,
- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiromamine or tridemorph,
- anilinopyrimidines, such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyprodinyl,
- 30 • antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,
- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinitroconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, ipconazole, metconazole,
35 myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizole or triticonazole,
- dicarboximides, such as iprodione, myclozolin, procymidone or vinclozolin,
- dithiocarbamates, such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram or zineb,
40
- heterocyclic compounds, such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadone, fenamidone,

- fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, picobenzamid, probenazole, proquinazid, pyrifenox, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, thlabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole or triforine,
- 5 • copper fungicides, such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride or basic copper sulfate,
- nitrophenyl derivatives, such as binapacryl, dinocap, dinobuton or nitrophthal-isopropyl,
- phenylpyrroles, such as fenpiclonil or fludioxonil,
- 10 • sulfur,
- other fungicides, such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, diclomezine, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, phosphorous acid, fosetyl-aluminum, iprovalicarb,
- 15 hexachlorobenzene, metrafenone, pencycuron, propamocarb, phthalide, tolclofos-methyl, quintozone or zoxamide,
- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- 20 • sulfenic acid derivatives, such as captan, dichlofluanid, folpet or tolylfluanid,
- cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

25 Synthesis examples

The procedures given in the synthesis examples below were, with appropriate modification of the starting materials, used to obtain further compounds I. The compounds obtained in this manner are listed in the table that follows, together with

30 physical data.

Example 1: Preparation of 6-(3-Bromopropyl)-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine [I-1]

- 35 At 20 to 25°C, 0.60 ml of 48% strength aqueous hydrobromic acid was added to a solution of 495 mg (1.7 mmol) of 5-ethyl-6-(3-pentyloxypropyl)-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine (preparation analogously to EP-A 141 317) in 5 ml of glacial acetic acid, and the mixture was then heated under reflux for 20 hours. After cooling, the volatile components were removed from the reaction mixture, the residue was
- 40 taken up in CH₂Cl₂/H₂O and the aqueous phase was washed with saturated NaHCO₃ solution until neutral. The organic phase was separated off, washed with water and

dried, and the solvent was removed. The residue gave, after chromatography on RP18 phase (MPLC isocratic; acetonitrile/water mixture), 0.21g of the title compound in the form of white crystals.

5 **Example 2: Preparation of**
7-Amino-6-(5-cyanopentyl)-5-ethyl-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pyrimidine

2.a) 4,9-Dicyanononan-3-one

- 10 5.6 g of ethyl propionate were added dropwise to a solution of 6.8 g of 1,6-dicyano-
hexane and 11.2 g of 95% pure potassium tert-butoxide in 100 ml of anhydrous
dimethylformamide (DMF). After the addition had ended, the reaction mixture was
stirred at 20 to 25°C for 17 hours and then diluted with water and washed with tert-butyl
methyl ether (MTBE). After acidification with concentrated HCl, the aqueous phase was
15 extracted with MTBE. This ether phase was washed with water and, after drying, freed
from the solvent. What remained were 7.1 g of the title compound as an oil which was
reacted without further purification.

2.b) 7-Amino-6-(5-cyanopentyl)-5-ethyltriazolo-(1,5-a)-pyrimidine [1-3]

- 20 4.76 g of 4,9-dicyanononan-3-one, 2.5 g of 3-amino-1H-1,2,4-triazole and 0.94 g of
p-toluenesulfonic acid in 25 ml of mesitylene were stirred at 170°C for four hours,
during which time small amounts of mesitylene were distilled off continuously. The
solvent was then distilled off, and the residue was taken up in dichloromethane and
25 water. After removal of insoluble components, the organic phase was washed with
water, saturated NaHCO₃ solution and saturated NaCl solution and then dried, and
volatile components were removed. The residue was digested with MTBE. After
removal of the solvent, 2.0 g of the title compound remained as colorless crystals of
m.p. 158-160°C.

30

Example 3: Preparation of
5-Ethyl-6-(5,6,8-trifluorohex-5-enyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine [1-5]

3a) Methyl 7,8,8-trifluoro-2-propionyloct-7-enoate

35

- At 20 to 25°C, 5.40 g of methanolic potassium methoxide solution (30% strength,
23 mmol) were added dropwise to a solution of 3.30g (23 mmol) of ethylpropionyl
acetate in 2.5ml of methanol. After 1 hour of stirring at this temperature and then
30 min of stirring at 40°C, 5.00 g (23 mmol) of 6-bromo-1,1,2-trifluoro-1-hexene were
40 added dropwise at 40°C over a period of 5 min. The reaction mixture was then stirred
at this temperature for 15 hours. The suspension formed was taken up in methyl tert-
butyl ether (MTBE) and then filtered through silica gel. The eluate was washed with

water and then with saturated NaCl solution and then dried, and the solvent was removed. What remained were 2.34 g of the title compound as a colorless oil.

3b) 5-Ethyl-6-(5,6,6-trifluorohex-5-enyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ol

5

A mixture of 5.28 mmol of methyl 7,8,8-trifluoro-2-propionyloct-7-enoate, 0.86 g (10.2 mmol) of 3-amino-1,2,4-triazole and 10 ml of propionic acid was heated under reflux for about 15 hours. The propionic acid was then distilled off, and the residue was chromatographed on silica gel (cyclohexane/ethyl acetate mixture). What remained

10

3c) 7-Chloro-5-ethyl-6-(5,6,6-trifluorohex-5-enyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine

15

0.60 g (2 mmol) of the compound from Ex. 3b) in 20 ml of phosphoryl chloride was heated under reflux for 15 hours. The volatile components were then distilled off, the residue was taken up in CH_2Cl_2 , the solution was washed with NaHCO_3 solution until neutral and dried and the solvent was removed. The residue gave, after chromatography on silica gel (ethyl acetate/methanol mixture), 0.38 g of the title compound as a yellow oil.

20

3d) 5-Ethyl-6-(5,6,6-trifluorohex-5-enyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine

25

A solution of 0.35g (1.1 mmol) of the compound from Ex. 3c) in 2 ml of methanol and 10 ml of a 7M methanolic NH_3 solution were stirred at 20 to 25°C for 48 hours. The solution was freed from the volatile components and the residue was suspended in water in an ultrasonic bath, filtered off and then dried. What remained was 0.21 g of the title compound in the form of white crystals of m.p. 199°C.

Table I - Compounds of the formula I

No.	R ¹	R ²	Phys. data (m.p. [°C]; ¹ H-NMR δ [ppm])
I-1	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$	CH_2CH_3	240-241
I-2	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	CH_2CH_3	8.4 (s, 1H), 7.8 (s, 2H), 3.7 (t, 2H), 2.8 (q, 2H), 2.7 (m, 2H), 1.9 (m, 2H), 1.2 (t, 3H).
I-3	$(\text{CH}_2)_6\text{CN}$	CH_2CH_3	158 - 160
I-4	$(\text{CH}_2)_5\text{CN}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	158
I-5	$(\text{CH}_2)_4\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_2CH_3	199
I-6	$(\text{CH}_2)_4\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	209-210
I-7	$(\text{CH}_2)_4\text{CF}=\text{CF}_2$	CH_3	190-191

Examples of the action against harmful fungi

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

5

The active compounds were prepared as a stock solution with 25 mg of active compound which was made up to 10 ml with a mixture of acetone and/or DMSO and the emulsifier Uniperok® EL (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkylphenols) in a ratio by volume of solvent/emulsifier of 99/1.

10 The mixture was then made up to 100 ml with water. This stock solution was, using the solvent/emulsifier/water mixture described, diluted to the active compound concentration stated below.

15 Use Example 1 – Activity against peronospora of grapevines caused by *Plasmopara viticola*

Leaves of potted vines were sprayed to runoff point with an aqueous suspension having the concentration of active compounds stated below. The next day, the undersides of the leaves were inoculated with an aqueous sporangia suspension of 20 *Plasmopara viticola*. The vines were then initially placed in a water-vapor-saturated chamber at 24°C for 48 hours and then in a greenhouse at temperatures between 20 and 30°C for 5 days. After this time, the plants were once more placed in a humid chamber for 16 hours to promote the eruption of sporangiophores. The extent of the development of the infection on the undersides of the leaves was then determined 25 visually.

In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of the compound I-7 showed no infection, whereas the untreated plants were 90% infected.

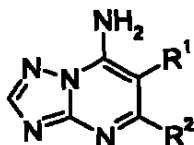
30 Use Example 2: Activity against late blight of tomatoes caused by *Phytophthora infestans*, protective treatment

Leaves of potted tomato plants were sprayed to runoff point with an aqueous suspension of the active compounds. Four days after the application, the leaves were infected with an 35 aqueous sporangia suspension of *Phytophthora infestans*. The plants were then placed on a water-vapor-saturated chamber at temperatures between 18 and 20°C. After 6 days the infection was determined visually in %.

40 In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of the compound I-7 showed no infection, whereas the untreated plants were 100% infected.

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



I

5 in which the substituents are as defined below:

R^1 is C_2 - C_{12} -alkenyl or C_2 - C_{12} -alkynyl, where the carbon chains are unsubstituted or carry one to three identical or different groups R^a and/or R^b :

10 or

C_1 - C_{14} -alkyl, C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_8 -alkoxy- C_2 - C_{12} -alkenyl or C_1 - C_8 -alkoxy- C_2 - C_{12} -alkynyl, where the carbon chains carry one to three identical or different groups R^a ;

15

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkylthio, C_3 - C_{12} -alkenyloxy, C_3 - C_{12} -alkynyloxy, $NR^{11}R^{12}$, or

20

C_3 - C_8 -cycloalkyl which may carry one to four identical or different groups R^b ;

R^b is C_1 - C_4 -alkyl, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -alkylthio, C_3 - C_8 -alkenyloxy, C_3 - C_8 -alkynyloxy and $NR^{11}R^{12}$;

25

R^{11} , R^{12} are hydrogen or C_1 - C_8 -alkyl;

where the carbon chains of the groups R^a for their part may be halogenated;

30

R^2 is C_1 - C_{12} -alkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl or C_2 - C_{12} -alkynyl, where the carbon chains are substituted by one to three groups R^c :

35

R^c is cyano, nitro, hydroxyl, $NR^{11}R^{12}$; or C_3 - C_8 -cycloalkyl which may carry one to four identical or different groups C_1 - C_4 -alkyl, halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -alkylthio, C_3 - C_8 -alkenyloxy, C_3 - C_8 -alkynyloxy or $NR^{11}R^{12}$.

2. The compound of the formula I as claimed in claim 1 in which

37

R^1 is C_1 - C_{14} -haloalkyl, C_1 - C_{12} -haloalkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl or C_2 - C_{12} -haloalkynyl, where the carbon chains may carry one to three groups R^a :

5 R^a is cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -alkylthio, C_3 - C_{12} -alkenyloxy, C_3 - C_{12} -alkynyloxy, $NR^{11}R^{12}$, or

C_3 - C_8 -cycloalkyl which may carry one to four identical or different groups R^b ;

10

R^b is C_1 - C_4 -alkyl, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -alkylthio, C_3 - C_8 -alkenyloxy, C_3 - C_8 -alkynyloxy and $NR^{11}R^{12}$

R^{11}, R^{12} are hydrogen or C_1 - C_8 -alkyl;

15

where the carbon chains of the groups R^a for their part may be halogenated.

3. The compound of the formula 1 as claimed in claim 1 or 2 in which

20

R^2 is C_1 - C_{12} -alkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl or C_2 - C_{12} -alkynyl, where the carbon chains may be substituted by one to three groups R^c :

25

R^c is cyano, nitro, hydroxyl, $NR^{11}R^{12}$; or C_3 - C_8 -cycloalkyl which may carry one to four identical or different groups C_1 - C_4 -alkyl, halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -alkylthio, C_3 - C_8 -alkenyloxy, C_3 - C_8 -alkynyloxy or $NR^{11}R^{12}$.

4. The compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 3 in which

30

R^1 is C_1 - C_{14} -alkyl, where the carbon chains carry one to three identical or different groups cyano or halogen.

5. The compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 3 in which

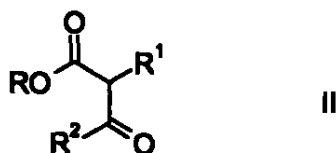
35

R^1 is C_2 - C_{12} -alkenyl or C_2 - C_{12} -alkynyl, where the carbon chains are unsubstituted or carry one to three identical or different groups R^a and/or R^b .

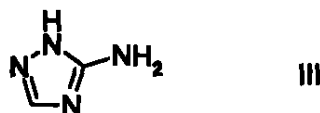
6. The compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 5 in which R^1 and R^2 together do not have more than 14 carbon atoms.

40

7. The compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 5 in which R¹ is 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, 1,1,1-trifluoroprop-2-yl, 1-chloropropyl, 1-fluoropropyl, 3-chloropropyl, 3-fluoropropyl, 3,3,3-trifluoropropyl, 1-chlorobutyl, 1-fluorobutyl, 4-chlorobutyl, 4-fluorobutyl, 4,4,4-trifluorobutyl, 1-chloropentyl, 1-fluoropentyl, 5,5,5-trifluoropentyl, 5-chloropentyl, 5-fluoropentyl, 1-chlorohexyl, 1-fluorohexyl, 6-chlorohexyl, 6-fluorohexyl, 6,6,6-trifluorohexyl, 1-chloroheptyl, 1-fluoroheptyl, 7-chloroheptyl, 7-fluoroheptyl, 7,7,7-trifluoroheptyl, 1-chlorooctyl, 1-fluorooctyl, 8-fluorooctyl, 8,8,8-trifluorooctyl, 1-chlorononyl, 1-fluorononyl, 9-fluorononyl, 9,9,9-trifluorononyl, 9-chlorononyl, 1-fluorodecyl, 1-chlorodecyl, 10-fluorodecyl, 10,10,10-trifluorodecyl, 10-chlorodecyl, 1-chloroundecyl, 1-fluoroundecyl, 11-chloroundecyl, 11-fluoroundecyl, 11,11,11-trifluoroundecyl, 1-chlorododecyl, 1-fluorododecyl, 12-chlorododecyl, 12-fluorododecyl or 12,12,12-trifluorododecyl.
8. The compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 7 in which R² is methyl, ethyl, isopropyl, n-propyl or n-butyl.
9. 6-(3-bromopropyl)-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
6-(3-chloropropyl)-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
6-(7-amino-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-6-yl)-hexanenitrile;
6-(7-amino-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-6-yl)-hexanenitrile;
5-ethyl-6-hex-5-enyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
6-hex-5-enyl-5-methyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-methyl-6-(5,6,8-trifluorohex-5-enyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine.
10. A process for preparing compounds of the formula I as claimed in any of claims 1 to 9 wherein β -ketoesters of the formula II,

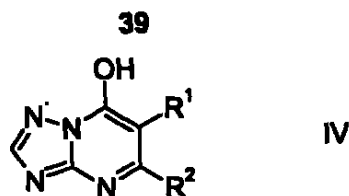


In which R is C₁-C₄-alkyl are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III

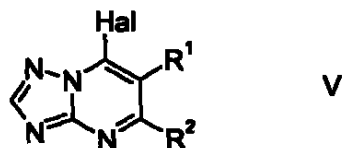


- to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula IV

64



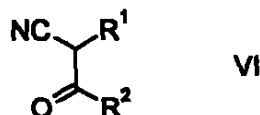
which are halogenated to give compounds of the formula V



in which Hal is chlorine or bromine and V is reacted with ammonia.

5

11. A process for preparing compounds of the formula I as claimed in any of claims 1 to 9 wherein acyicyanides of the formula VI,



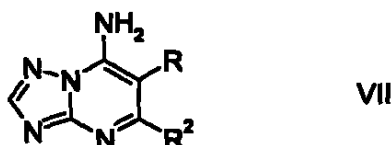
are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III as claimed in claim 10.

10

12. A compound of the formula IV or V as set forth in claim 10.

13. A process for preparing compounds of the formula I as claimed in claim 1 in which R¹ is halogen-substituted C₁-C₁₄-alkyl, C₁-C₁₂-alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₂-C₁₂-alkenyl or C₂-C₁₂-alkynyl, by halogenating triazolopyrimidines of the formula VII,

15



in which R is C₁-C₁₄-alkyl, C₁-C₁₂-alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₂-C₁₂-alkenyl, C₂-C₁₂-alkynyl, where the carbon chains may carry one to three groups R⁸ as set forth in claim 1, using a halogenating agent in the presence of a free-radical initiator or an acid.

20

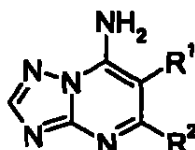
14. A fungicidal composition comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 7.
- 25 15. Seed comprising a compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 9 in an amount of 1 to 1000 g per 100 kg.
- 30 16. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi wherein the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack are treated with an effective amount of a compound of the formula I as claimed in any of claims 1 to 9.

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines, their preparation and their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising these compounds

Abstract

5

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are as defined below:

10 R¹ is alkyl, alkoxyalkyl, alkenyl or alkynyl;

R² is alkyl, alkoxyalkyl, alkenyl or alkynyl;

where R¹ and/or R² are substituted as defined in the description;

15

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

PF 55416

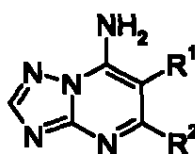
5,6-Dialquil-7-amino-triazolopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

Descripción

5

La presente invención se refiere a 5,6-dialquil-7-amino-triazolopirimidinas de la fórmula

I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10

R^1 significa C_2-C_{12} -alquenilo o C_2-C_{12} -alquinilo, pudiendo las cadenas de carbono estar no sustituidas o llevar uno a tres grupos R^a y/o R^b iguales o diferentes;

o

15

C_1-C_{14} -alquilo, C_1-C_{12} -alcoxi- C_1-C_{12} -alquilo, C_1-C_8 -alcoxi- C_2-C_{12} -alquenilo o C_1-C_8 -alcoxi- C_2-C_{12} -alquinilo, llevando las cadenas de carbono uno a tres grupos R^a iguales o diferentes;

20

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_1-C_8 -alquiltio, C_3-C_{12} -alqueniloxi, C_3-C_{12} -alquiniloxi, $NR^{11}R^{12}$, o

}

PF 55416

2

C₃-C₈-dicoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos iguales o diferentes;

5 R^b es C₁-C₄-alquilo, clano, nitro, hidroxí, C₁-C₈-alcoxi, C₁-C₈-alquiltio, C₃-C₈-alqueniloxi, C₃-C₈-alquíniloxi y NR¹¹R¹²

R¹¹, R¹² significan hidrógeno o C₁-C₈-alquilo;

10 pudiendo las cadenas de carbono de los grupos R^a a su vez estar halogenadas;

R² es C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₁-alcoxi-C₁-C₁₁-alquilo, C₂-C₁₂-alquenilo o C₂-C₁₂-alquínilo, estando las cadenas de carbono sustituidas por uno a tres grupos R^c

15 R^c es ciano, nitro, hidroxí, NR¹¹R¹², o C₃-C₈-dicoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos C₁-C₄-alquilo iguales o diferentes, halógeno, clano, nitro, hidroxí, C₁-C₈-alcoxi, C₁-C₈-alquiltio, C₃-C₈-alqueniloxi, C₃-C₈-alquíniloxi, NR¹¹R¹².

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

25 En la GB 1 148 629 se proponen en términos generales las 5,6-dialquil-7-amino-triazolopirimidinas. De la EP-A 141 317 se conocen algunas 5,6-dialquil-7-amino-

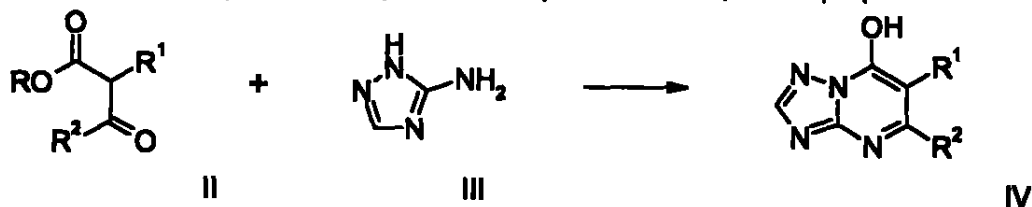
triazolopirimidinas de acción fungicida. Sin embargo, su efecto es en muchos casos no satisfactorio. Partiendo de ello, la presente invención tiene por objeto proveer compuestos con efecto mejorado y/o espectro de acción más amplio.

- 5 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 de la fórmula I se distinguen de los compuestos mencionados en las publicaciones arriba citadas en la configuración especial del sustituyente en la posición 6 del esqueleto de triazolopirimidina, que representa un grupo halógenoalquilo o un grupo alifático no saturado.

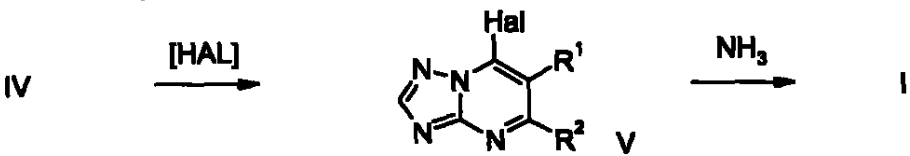
Los compuestos de la fórmula I presentan un efecto más alto contra hongos nocivos que los compuestos conocidos..

Los compuestos según la invención pueden prepararse mediante diferentes métodos. Ventajosamente, se preparan los compuestos según la invención, transformando β-ceto ésteres sustituidos de la fórmula II con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III en 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV. Los grupos R¹ y R² en las fórmulas II y IV tienen los significados indicados para la fórmula I y el grupo R en la fórmula II representa alquilo C₁-C₄, por razones prácticas se prefiere metilo, etilo o propilo.



La reacción de los β -ceto ésteres de la fórmula II con los aminoazoles de la fórmula III puede realizarse en presencia o ausencia de disolvente. Ventajosamente, se usan aquellos disolventes, que son substancialmente inertes frente a los insumos y en los que estos últimos son parcial o completamente solubles. disolventes apropiados son, especialmente, alcoholes, tales como etanol, propanoles, butanoles, glicoles o mono-éteres glicólicos, dietilenglicoles o sus monoéteres, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, benceno o mesitileno, amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamida, dibutilformamida, N,N-dimetilacetamida, ácidos alcanoicos inferiores, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o bases, tales hidróxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, óxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, hidruros de metal alcalino y alcalinotérreo, amidas de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, así como hidrogencarbonatos 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, triisopropilamina, tributilamina y N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, piridina, piridinas sustituidas, tales como colidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, así como aminas bicíclicas y mezclas de estos disolventes con agua. Como catalizadores son apropiadas las bases, p.ej. las arriba mencionadas, o ácidos, p.ej. ácido sulfónico o ácidos minerales. Muy preferentemente, se realiza la reacción sin disolvente o en clorobenceno, xileno, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona. Bases especialmente preferidas son las aminas terciarias, tales como tri-isopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina o N-metilpiperidina. Las temperaturas varían entre 50 y 300°C, preferentemente, de 50 a 180°C, cuando se trabaja en solución [ver EP-A 770 615; Adv. Het. Chem. Vol. 57, págs. 81 y sig. (1993)].

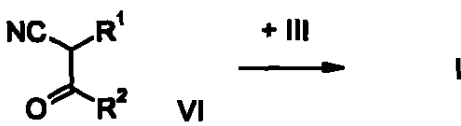
Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también pueden ser usadas en cantidad equimolar, en exceso o como disolvente.



- Los productos de condensación de la fórmula IV así obtenidos, generalmente, se precipitan a partir de las soluciones de reacción en forma pura y se transforman, después de haberlas lavado con los mismos disolventes o con agua y secado, con agentes de halogenación, especialmente agentes de cloración o de bromación, en los compuestos de la fórmula V, donde Hal representa cloro o bromo, especialmente cloro. Preferentemente se efectúa la reacción con agentes de cloración, tales como oxidloruro de fósforo, cloruro de tionilo o cloruro de sulfurilo a 50°C hasta 150°C, preferentemente, en oxitricloruro fosfórico excesivo a temperatura de reflujo. Después de haberse evaporado el oxitricloruro fosfórico excesivo se trata el residuo con agua helada, en caso dado, adicionando un disolvente no miscible con agua. El producto de cloración aislado de la fase orgánica secada, eventualmente tras evaporación del disolvente inerte, generalmente, es muy puro y se transforma, luego con amoníaco en disolventes inertes a 100°C hasta 200°C en las 7-amino-triazolo[1,5-a]-pirimidinas. La reacción se efectúa, preferentemente, con un exceso 1 a 10 veces molar en amoníaco bajo una presión de 1 a 100 bar.
- Las nuevas 7-amino-azolo[1,5-a]-pirimidinas se aíslan, opcionalmente tras evaporación del disolvente, por digestión en agua como compuestos cristalinos.

Los β-ceto ésteres de la fórmula II pueden ser preparados en la forma descrita en Organic Synthesis Coll. Vol. 1, p. 248, o se obtienen en el comercio.

Alternativamente, se puede preparar los nuevos compuestos de la fórmula I, haciendo
5 reaccionar acilcianuros sustituidos de la fórmula VI, donde R¹ y R² tienen los significados arriba indicados, con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III.



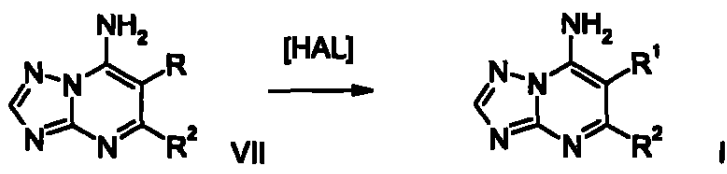
La reacción puede realizarse en presencia o ausencia de disolvente. Ventajosamente,
10 se usan aquellos disolventes, que son substancialmente inertes frente a los insumos y en los que estos últimos son parcial o completamente solubles. disolventes apropiados son, especialmente, alcoholes, tales como etanol, propanoles, butanoles, glicoles o monoéteres glicólicos, dietilenglicoles o sus monoéteres, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, benceno o mesitileno, amidas, tales como dimetilformamida, dietil-
15 formamida, dibutilformamida, N,N-dimetilacetamida, ácidos alcanoicos inferiores, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o bases, tales como los arriba mencionados, y mezclas de estos disolventes con agua. Las temperaturas de reacción varían de entre 50 y 300°C, preferentemente, de 50 hasta 150°C, cuando se trabaja en solución.

20

Los alquilcianuros sustituidos de la fórmula VI, necesarios para la preparación de las 7-amino-azolo[1,5-a]-pirimidinas son en parte conocidos o pueden ser preparados mediante métodos en si conocidos a partir de alquilcianuros y ésteres carboxílicos con

bases fuertes, p.ej. hidruros alcalinos, alcoholatos de metal alcalino, amidas alcalinas o alqueno metálico (ver: J. Amer. Chem. Soc. Vol. 73, (1951) p. 3766).

Los compuestos de la fórmula I, en la que R¹ significa C₁-C₁₄-halógenoalquilo, C₁-C₁₂-
5 halógenoalkoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-halogenalquilo, C₂-C₁₂-
halógenoalquenilo o C₂-C₁₂-halógenoalquinilo, se pueden obtener por halogenación de
las correspondientes triazolopirimidinas de la fórmula VII:



10 En la fórmula VII, R representa C₁-C₁₄-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-
alquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, pudiendo las cadenas de carbono llevar uno a tres grupos
R^a.

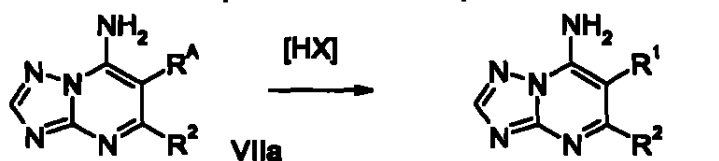
La halogenación se realiza, generalmente, a temperaturas de 0°C a 200°C, preferen-
15 temente, 20°C a 110°C, en un disolvente orgánico inerte, en presencia de un iniciador
de radicales libres p.ej. peróxido de dibenzilo o azobisisobutironitrilo o bajo irradia-
ción ultravioleta, p.ej. con una lámpara de vapor de Hg-) o un ácido [ver Synthetic Rea-
gents, Vol. 2, p. 1-63, editorial Wiley, New York (1974)].

Los componentes de reacción se transforman entre si en cantidades equimolares. Pe-
20 ro para el rendimiento puede ser ventajoso usar en agente de halogenación en un ex-
ceso con respecto a VII.

Como agente de halogenación se puede usar halógeno elemental (p.ej. Cl₂, Br₂, J₂), N-bromo-succinimida, N-cloro-succinimida o dibromodimetilhidrantoína. Los agentes de halogenación se usan, generalmente en cantidad equimolar, en exceso o, en caso dado, como disolvente.

5

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa C₁-C₁₄-halógenoalquilo, C₂-C₁₂-halógenoalquenilo o C₂-C₁₂-halógenoalquinilo, se pueden preparar, alternativamente, por separación de éter de correspondientes triazoloprimidinas de la fórmula VIIa:



- 10 En la fórmula VIIa, R^A representa C₁-C₁₄-alquilo, C₂-C₁₂-alquenilo o C₂-C₁₂-alquinilo, estando los grupos R^A sustituidos por grupos hidroxil o alcoxi. Calentando los compuestos VIIa en presencia de ácidos minerales [HX], tales como ácido clorhídrico o ácido bromhídrico o ácido nítrico, se obtienen los compuestos I [ver Organikum, 15a edición, p. 237 y sig., VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1981].

15

Las triazoloprimidinas de la fórmula VII necesarias para la preparación de los compuestos I arriba descritos son en parte conocidos o pueden ser preparados mediante métodos conocidos [ver EP-A 141 317].

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

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

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

10 halógeno: fluoro, cloro, bromo e yodo;

alquilo: radicales hidrocarburo saturados, lineales o ramificados con 1 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono, p.ej. C₁-C₄-alquilo, tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

20

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 2, 4 ó 6 átomos de carbono (como los arriba mencionados), pudiendo los átomos de hidrógeno en estos grupos estar parcial o completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los antes mencionados: especialmente, C₁-C₂-halógenoalquilo, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,

25

rometilo, 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 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

5

alquenilo: radicales hidrocarburo no saturados, lineales o ramificados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en una posición arbitraria, p.ej.

C₂-C₈-alquenilo, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-

10 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-

15 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-

20 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-

25 propenilo;

- alcoxialquilo: cadena de hidrocarburo saturada, lineal o una, dos o tres veces ramificada, que está interrumpida por un átomo de oxígeno, por ejemplo, C_5-C_{12} -alcoxialquilo: cadena de hidrocarburo como la arriba descrita con 5 a 12 átomos de carbono, que
- 5 puede estar interrumpida por un átomo de oxígeno en una posición arbitraria, p.ej. propoxi-etilo, butoxi-etilo, pentoxi-etilo, hexiloxi-etilo, heptiloxi-etilo, octiloxi-etilo, noniloxi-etilo, 3-(3-etil-hexiloxi)-etilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-etilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-etilo, etoxi-propilo, propoxi-propilo, butoxi-propilo, pentoxi-propilo, hexiloxi-propilo, heptiloxi-propilo, octiloxi-propilo, noniloxi-propilo,
- 10 3-(3-etil-hexiloxi)-propilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-propilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-propilo, etoxi-butilo, propoxi-butilo, butoxi-butilo, pentoxi-butilo, hexiloxi-butilo, heptiloxi-butilo, octiloxi-butilo, noniloxi-butilo, 3-(3-etil-hexiloxi)-butilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-butilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-butilo, metoxi-pentilo, etoxi-pentilo, propoxi-pentilo, butoxi-pentilo, pentoxi-pentilo, hexiloxi-pentilo, heptiloxi-pentilo, 3-(3-metil-hexiloxi)-
- 15 pentilo, 3-(2,4-dimetil-pentiloxi)-pentilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-pentilo;

- halógenoalqueno: radicales hidrocarburo: no saturados, lineales o ramificados con 2 a 10 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 parcial
- 20 o completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los antes mencionados, especialmente, fluro, cloro y bromo;

- alquinilo: grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 4, 6, 8 ó 10 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en una posición arbitraria, p.ej. C_2-C_8 -alquinilo,
- 25 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;

cilcoalquilo: grupos hidrocarburo mono o bicíclicos con 3 a 6 miembros anulares de carbono, p.ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

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.

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 si solos como también en combinaciones:

Son preferidos los compuestos I, en los que el grupo R¹ presenta, como máximo, 9 átomos de carbono.

Son igualmente preferidos los compuestos de la fórmula I, en los que R¹ representa un grupo halógeno alquilo no ramificado o una, dos, tres o más veces ramificado.

Si R¹ significa halógenoalquilo, la halogenación se encuentra, preferentemente, en el átomo de carbono terminal. Se prefieren los grupos monohalógenoalquilo.

En una variante de los compuestos según la invención I, R¹ representa C₁-C₁₄-

- 5 halógenoalquilo, C₁-C₁₂-halógenoalcóxido-C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-alcóxido-C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₂-C₁₂-halógenoalquenoilo o C₂-C₁₂-halógenoalquinoilo, cuyos grupos presentan uno o dos átomos de halógeno. Aquí se prefieren, especialmente, los grupos C₁-C₈-halógenoalcóxido-propilo y C₁-C₈-alcóxido-halogenopropilo.

- 10 En otra variante de los compuestos I, R¹ representa un grupo C₁-C₁₄-halógenoalquilo, C₁-C₁₂-halógenoalcóxido-C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-alcóxido-C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₂-C₁₂-halógenoalquenoilo o C₂-C₁₂-halógenoalquinoilo, cuyos grupos contienen un átomo de halógeno; el átomo de halógeno se encuentra, preferentemente, en el átomo de carbono en la posición α.

15

También se prefieren los de la fórmula I, en los que R¹ representa un grupo (CH₂)_nCH₂Cl, (CH₂)_nCH₂Br, CH(CH₃)(CH₂)_mCH₂Cl, CH(CH₃)(CH₂)_mCH₂Br, (CH₂)_nCF₃ oder CH(CH₃)(CH₂)_mCF₃, donde n es un número de 0 a 13 y m es un número de 0 a 11.

20

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa 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, 1,1,1-

25

- trifluoroprop-2-ilo, 1-cloropropilo, 1-fluoropropilo, 3-cloropropilo, 3-fluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 1-clorobutilo, 1-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-fluorobutilo, 4,4,4-trifluorobutilo, 1-cloropentilo, 1-fluoropentilo, 5,5,5-trifluoropentilo, 5-cloropentilo, 5-fluoropentilo, 1-clorohexilo, 1-fluorohexilo, 6-clorohexilo, 6-fluorohexilo, 6,6,6-trifluorohexilo, 1-cloroheptilo, 1-fluoroheptilo, 7-cloroheptilo, 7-fluoroheptilo, 7,7,7-trifluoroheptilo, 1-clorooctilo, 1-fluorooctilo, 8-fluorooctilo, 8,8,8-trifluorooctilo, 1-clorononilo, 1-fluorononilo, 9-fluorononilo, 9,9,9-trifluorononilo, 9-clorononilo, 1-fluorodecilo, 1-clorodecilo, 10-fluorodecilo, 10,10,10-trifluorodecilo, 10-clorodecilo, 1-cloroundecilo, 1-fluoroundecilo, 11-cloroundecilo, 11-fluoroundecilo, 11,11,11-trifluoroundecilo, 1-clorododecilo, 1-fluorododecilo, 12-clorododecilo, 12-fluorododecilo o 12,12,12-trifluorododecilo.

- En otra variante de los compuestos I, R^1 representa C_2-C_{12} -alquenilo o C_2-C_{12} -alquínilo, pudiendo las cadenas de carbono estar no sustituidas o llevar uno a tres grupos R^a y/o R^b iguales o diferentes.

En una variante preferida de los compuestos de la fórmula I no está presente ningún grupo R^a .

- Son especialmente preferidos los compuestos, en los que la cadena de carbono de R^1 y R^2 presentan conjuntamente, como máximo, 14 átomos de carbono.

- En una variante de los compuestos según la invención I, R^2 significa metilo, etilo, isopropilo, n-propil o n-butilo, especialmente, metilo, etilo, iso o n-propilo, sobre todo, metilo o etilo.

Los átomos de halógeno en los grupos R¹ y/o R² se encuentran, preferentemente, en el átomo de carbono α .

- 5 Los grupos ciano en R¹ y/o R² se encuentran, preferentemente, en el átomo de carbono.

En otra variante de los compuestos de la fórmula I no está presente ningún grupo R^b.

- 10 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.

15 Tabla 1

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A y R² significa metilo

Tabla 2

- 20 Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A y R² significa etilo

Tabla 3

- 25 Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A y R² significa n-propilo

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A y R² significa Iso-propilo

5

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I, en los que R¹ representa un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A y R² significa n-butilo

10 Tabla A

No.	R ¹
A-1	CH ₂ F
A-2	CH ₂ Cl
A-3	CH ₂ Br
A-4	CHF ₂
A-5	CHCl ₂
A-6	CF ₃
A-7	CCl ₃
A-8	CHFCH ₃
A-9	CHClCH ₃
A-10	CH ₂ CH ₂ F
A-11	CH ₂ CH ₂ Cl
A-12	CH ₂ CH ₂ Br
A-13	CCl ₂ CH ₃
A-14	CF ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CHF ₂
A-16	CH ₂ CHCl ₂
A-17	CH ₂ CF ₃
A-18	CH ₂ CCl ₃
A-19	CF ₂ CF ₃

No.	R ¹
A-20	CCl_2CCl_3
A-21	$\text{CHFCH}_2\text{CH}_3$
A-22	$\text{CHClCH}_2\text{CH}_3$
A-23	$\text{CH}_2\text{CHFCH}_3$
A-24	$\text{CH}_2\text{CHClCH}_3$
A-25	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$
A-26	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
A-27	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$
A-28	$\text{CCl}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-29	$\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-30	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHF}_2$
A-31	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHCl}_2$
A-32	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$
A-33	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$
A-34	$\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$
A-35	$\text{CCl}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$
A-36	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$
A-37	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{F}$
A-38	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Cl}$
A-39	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Br}$
A-40	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CHF}_2$
A-41	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CHCl}_2$
A-42	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{F})_2$
A-43	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{Cl})_2$
A-44	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{Br})_2$
A-45	$\text{CH}(\text{CHF}_2)_2$
A-46	$\text{CH}(\text{CHCl}_2)_2$
A-47	$\text{CHFCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-48	$\text{CHClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-49	$\text{CH}_2\text{CHFCH}_2\text{CH}_3$

No.	R ¹
A-50	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-51	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-52	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-54	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-55	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-56	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-57	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-58	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-59	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-60	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-61	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-62	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-63	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-64	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ F
A-65	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Cl
A-66	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Br
A-67	CH(CH ₃)CH ₂ CF ₃
A-68	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-69	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-71	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-72	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-74	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-75	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-76	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-77	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-78	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-79	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ¹
A-80	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-81	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-82	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-83	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-84	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-85	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-86	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-87	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-88	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-89	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-90	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-91	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-92	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-93	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-94	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-95	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-96	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-97	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-98	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-99	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-100	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-101	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-102	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-103	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-104	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-105	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-106	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-107	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-108	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-109	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃

No.	R ¹
A-110	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-111	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-112	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-113	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-114	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-115	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-116	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-117	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-118	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-119	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-120	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-121	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-122	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-123	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-124	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-125	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-126	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-127	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-128	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-129	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-130	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-131	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-132	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-133	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-134	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-135	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-136	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-137	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-138	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-139	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br

[illegible]

No.	R ¹
A-200	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-201	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-202	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-203	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-204	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-205	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-206	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-207	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-208	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-209	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-210	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-211	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-212	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-213	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-214	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-215	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-216	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-217	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-218	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-219	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-220	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-221	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-222	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-223	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-224	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-225	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-226	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
A-227	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-228	CH=CH ₂
A-229	CH ₂ CH=CH ₂

No.	R ¹
A-230	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-231	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$
A-232	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-233	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-234	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-235	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$
A-236	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-237	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-238	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-239	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-240	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-241	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-242	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-243	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-244	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-245	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-246	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-247	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-248	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-249	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-250	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-251	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-252	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-253	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-254	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-255	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-256	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-257	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-258	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-259	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

No.	R ¹
A-260	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-261	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-262	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-263	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-264	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-265	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-266	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-267	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-268	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-269	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-270	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-271	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-272	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-273	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-274	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-275	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-276	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-277	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-278	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-279	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-280	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-281	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-282	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-283	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-284	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-285	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-286	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-287	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-288	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-289	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$

No.	R ¹
A-290	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-291	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-292	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-293	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-294	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-295	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-296	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-297	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-298	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-299	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-300	$\text{C}\equiv\text{CH}$
A-301	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-302	$\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-303	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-304	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-305	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-306	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}\equiv\text{CH}$
A-307	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-308	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-309	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-310	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-311	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-312	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-313	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-314	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-315	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-316	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-317	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-318	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-319	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$

No.	R ¹
A-320	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-321	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-322	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-323	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-324	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-325	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-326	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-327	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-328	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-329	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-330	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-331	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-332	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-333	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-334	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-335	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-336	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-337	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-338	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-339	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-340	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-341	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-342	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-343	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-344	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-345	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-346	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-347	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-348	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-349	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$

43
93

No.	R ¹
A-350	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-351	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-352	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-353	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-354	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-355	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-356	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-357	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-358	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-359	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-360	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-361	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-362	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-363	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-364	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-365	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-366	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-367	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-368	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-369	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-370	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-371	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-372	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-373	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-374	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-375	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CN}$
A-376	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-377	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-378	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-379	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$

No.	R ¹
A-380	<chem>CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-381	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-382	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-383	<chem>CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-384	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-385	<chem>CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CN</chem>
A-386	<chem>CH(CH3)CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-387	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-388	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-389	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-390	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-391	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-392	<chem>CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-393	<chem>CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-394	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-395	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-396	<chem>CH2CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CN</chem>
A-397	<chem>CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-398	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-399	<chem>CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CH2CN</chem>
A-400	<chem>CH(CH3)CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-401	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-402	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-403	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-404	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-405	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-406	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-407	<chem>CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-408	<chem>CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-409	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>

No.	R ¹
A-410	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-411	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-412	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-413	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-414	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-415	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-416	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-417	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-418	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-419	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-420	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-421	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-422	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-423	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-424	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-425	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-426	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-427	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN
A-428	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-429	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-430	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-431	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-432	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-433	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-434	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-435	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CN
A-436	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-437	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃)CH ₂ CN
A-438	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CN
A-439	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN

No.	R ¹
A-440	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CN</chem>
A-441	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-442	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-443	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-444	<chem>CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-445	<chem>CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-446	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-447	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CN</chem>
A-448	<chem>CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-449	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-450	<chem>CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-451	<chem>CH(CH3)CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-452	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-453	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-454	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-455	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-456	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-457	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-458	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-459	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-460	<chem>CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-461	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CN</chem>
A-462	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-463	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-464	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-465	<chem>CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-466	<chem>CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-467	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-468	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-469	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>

No.	R ¹
A-470	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-471	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-472	<chem>CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CN</chem>
A-473	<chem>CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-474	<chem>CH2CH(CH3)CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-475	<chem>CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-476	<chem>CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-477	<chem>CH(CH3)CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-478	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-479	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-480	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-481	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-482	<chem>CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-483	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CN</chem>
A-484	<chem>CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-485	<chem>CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH(CH3)CH2CH2CN</chem>
A-486	<chem>CH2CH(CH3)CH2CH2CH2CH2CH2C(CH3)2CH2CN</chem>
A-487	<chem>CHFCH2CN</chem>
A-488	<chem>CHClCH2CN</chem>
A-489	<chem>CCl2CH2CN</chem>
A-490	<chem>CF2CH2CN</chem>
A-491	<chem>CHFCH2CH2CN</chem>
A-492	<chem>CHClCH2CH2CN</chem>
A-493	<chem>CCl2CH2CH2CN</chem>
A-494	<chem>CF2CH2CH2CN</chem>
A-495	<chem>CHFCH2CH2CH2CN</chem>
A-496	<chem>CHClCH2CH2CH2CN</chem>
A-497	<chem>CCl2CH2CH2CH2CN</chem>
A-498	<chem>CF2CH2CH2CH2CN</chem>
A-499	<chem>CHFCH2CH2CH2CH2CN</chem>

A-500	<chem>CHClCH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-501	<chem>CCl2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-502	<chem>CF2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-503	<chem>CHFCH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-504	<chem>CHClCH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-505	<chem>CCl2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-506	<chem>CF2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-507	<chem>CHFCH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-508	<chem>CHClCH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-509	<chem>CCl2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-510	<chem>CF2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-511	<chem>CHFCH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-512	<chem>CHClCH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-513	<chem>CCl2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-514	<chem>CF2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-515	<chem>CHFCH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-516	<chem>CHClCH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-517	<chem>CCl2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-518	<chem>CF2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-519	<chem>CHFCH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-520	<chem>CHClCH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-521	<chem>CCl2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>
A-522	<chem>CF2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CN</chem>

Los compuestos I son apropiados como fungicidas. Se destacan por ser excelente-
mente efectivos contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, especialmente,
de la clase de los *ascomicetos*, *deuteromicetos*, *oomicetos* y *basidiomicetos* especial-
5 mente, de la clase de los *oomicetos*. En parte son sistémicamente activos y pueden
ser usados en la protección de plantas como desinfectantes, fungicidas foliares y del
suelo.

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

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
- especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
- 10 • *Blumeria graminis* (oídio) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- *Bremia lactucae* en lechuga,
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
- 15 • especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- especies de *Peronospora* en col y cebollas,
- *Phakopsora pachyrhizi* y *P. meibomia* en soja,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Phytophthora capsici* en pepinos,
- 20 • *Plasmopara viticola* en vid,
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales,
- 25 • *Pyricularia oryzae* en arroz,

- *Pythium aphanidermatum* en césped,
- especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- *Uncinula necator* en vid,
- 5 • especies de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, así como
- especies de *Venturia* (roña) en manzanas y peras

Son especialmente apropiados para combatir hongos nocivos de la clase de los oomycetos, p.ej. especies de *Peronospora*, especies de *Phytophthora*, *Plasmopara viticola* y

10 especies de *Pseudoperonospora*.

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

15

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

20

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

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

En el tratamiento de las semillas se necesitan, generalmente, las cantidades de ingrediente activo de 1 a 1000 g/100 kg, preferentemente, de 5 a 100 g/ 100kg de semillas.

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

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

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

- agua, disolventes aromáticos (p.ej. productos Solvesso, xileno), parafinas (p.ej. fracciones de petróleo), alcoholes (p.ej. metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico)

co), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grasos y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,

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

10

Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además,

- 15 condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polloxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino
20 etoxilado, éteres alquílicos de polloxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfiticas y metilcelulosa.

- Sustancias apropiadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite directamente pulverizables son: fracciones de aceite mineral de
25

- punto de ebullición mediano hasta elevado, como p.ej. keroseno o aceite diesel, además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina, tetrahidro-naftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol,
- 5 ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

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

10

- Los granulados (p.ej. granulados recubiertos, impregnados o homogéneos) se pueden 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
- 15 calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, plásticos molidos, así como abonos, tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos vegetales, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras de nueces, polvos de celulosa u otros soportes sólidos.

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

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

25

A) Concentrados solubles en agua (SL)

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

B) Concentrados dispersables (DC)

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

C) Concentrados emulsionables (EC)

15 15 partes en peso de los principios activos son 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)

20

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

PF 55416

40

sión.

E) Suspensiones (SC, OD)

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

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

- 50 partes en peso de los principios activos son 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.
- 15

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

- 20 75 partes en peso de los principios activos son molidos en un molino de rotor-estator adicionando dispersante, humectantes y gel de sílice. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable con el principio activo.

2. Productos para la aplicación directa

25

H) Polvos pulverizables (DP)

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

5

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.

10

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

15

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 acalite directamente pulverizables, pastas, polvos pulverizables, agente de rociado o de regado.

20

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
5 agua con la ayuda de un humectante, agente adherente, dispersante o emulsionante. Alternativamente, se pueden preparar concentrados compuestos de la sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante, en caso dado, disolvente o aceite, y tales concentrados son apropiados para ser diluidos con agua.

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

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

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

Cuando se usan como fungicidas, los fungicidas de la invención pueden estar presen-
25 tes también junto con otros ingredientes activos, por ejemplo, con herbicidas, insectic-

das, reguladores del crecimiento, fungicidas u otros fertilizantes. Cuando se mezclan los compuestos l o las composiciones según la invención como fungicidas con otros fungicidas, entonces se alcanza, frecuentemente, ampliar el espectro de acción.

- 5 La siguiente lista de fungicidas con los que se pueden mezclar los compuestos según la invención sirve para ilustrar las combinaciones posibles, pero no debe entenderse como limitativa:
- acilalaninas, tales como benalaxilo, matalaxilo, ofurace, oxadixilo,
 - 10 • derivados de amina, tales como aldimorf, dodine, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminocadina, esprixamina, tridemorf,
 - anilnopyrimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirim o ciprodinilo,
 - antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxona o estreptomycin,
 - 15 • azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol,
 - 20 • dicarboximidas, tales como iprodiona, miozolina, procimidona, vinclozolina,
 - 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, ditlanona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotilano, mepronilo,
 - 25

nuarimol, picobenzamida, probenazol, proquinazida, pirfenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina,

- fungicidas de cobre, tales como caldo de burdeos, acetato de cobre, oxícloruro de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacril, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles, tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,
- azufre
- 10 • otros fungicidas, tales como acbenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclomezina, dicloclmet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, ferlmzona, fluazinam, ácido fosforoso, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida,
- 15 • estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picostrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico, tales como captan, captan, diclofluanida, folpet, toli-
- 20 fluanida,
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

Ejemplos de síntesis

- 25 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.

5 Ejemplo 1: Preparación de

6-(3-bromopropil)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina [I-1]

Una solución de 495 mg (1,7 mmol) de 5-etil-6-(3-pentiloxipropil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina (preparación análogamente a la EP-A 141 317) en 5 ml de aceite
10 helado se mezcla a 20 a 25°C 0,60 ml con ácido bromhídrico acuoso al 48% y luego se calienta a reflujo durante 20 horas. Después de estar fría se libera la mezcla de reacción de los componentes volátiles y se absorbe el residuo en CH₂Cl₂/H₂O y se lava la fase acuosa con solución saturada de NaHCO₃ hasta neutralidad. La fase orgánica se separó, se lavó con agua y se libró del disolvente. A partir del residuo se obtienen tras
15 cromatografía en fase de RP18 (MPLC isocrática; mezcla de acetonitrilo-agua-) 0,21g del compuesto indicado en el título en forma de cristales blancos.

Ejemplo 2: Preparación de

7-Amino-6-(5-cianopentil)-5-etil-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidina

20

2.a) 4,9-Dicianononan-3-ona

A una solución de 6,8 g 1,6-dicianohexano y 11,2 g de terc.-butilato de potasio al 95% en 100 ml de dimetilformamida anhidra (DMF) se agregan en gotas 5,6 g de propiona-
25 to de etilo. Terminada la adición, se agitan 17 horas a 20 a 25°C, luego se diluye la

mezcla de reacción con agua y se lava con éter terc.-butilmetílico (MTBE). Después de acidificar con HCl concentrado se extrae la fase acuosa con MTBE. Esta fase de éter se lava con agua, y después del secado se libera del disolvente. Quedan 7,1 g del compuesto indicado en el título como aceite, que se transforma sin purificación ulterior.

5

2.b) 7-Amino-6-(5-clanopentil)-5-etil-triazolo-(1,5-a)-pirimidina [I-3]

4,76 g de 4,8-dicianononan-3-ona, 2,5 g de 3-amino-1H-1,2,4-triazol y 0,94 g de ácido p-toluenosulfónico se agitan durante cuatro horas en 25 ml de mesitileno a 170°C, des-
10 tilándose continuamente un poco del mesitileno. Luego se destila el disolvente y se absorbe el residuo en diclorometano y agua. Después de haber separado los componentes insolubles se lava la fase orgánica con agua, solución saturada de NaHCO₃ y solución saturada de NaCl, luego se seca y se eliminan los componentes volátiles. El residuo se diluye en MTBE. Después de haber separado el disolvente quedan 2,0 g
15 del compuesto indicado en el título como cristales incoloros del p.f. 158 – 160°C.

Ejemplo 3: Preparación de

5-Etil-6-(5,6,6-trifluoro-hex-5-enil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina [I-5]

20

3a) 7,8,8-Trifluoro-2-propionil-oct-7-enoato de metilo

A una solución de 3,30g (23mmol) de acetato de etilpropionilo en 2,5ml de metanol se agregan en gotas 5,40g de solución metanólica de metilato de potasio (al 30%lg, 23

mmol) a 20 a 25°C. Después de haber agitado durante 1 hora a esta temperatura y durante 30 min a 40°C, se agregan en gotas 5,00g (23 mmol) de 6-bromo-1,1,2-trifluoro-1-hexeno a 40°C durante 5 min. Entonces se agita la mezcla de reacción durante 15 horas a esta temperatura. La suspensión formada se absorbe en metil-terc.-
5 butil éter (MTBE) y se filtra sobre silicagel. El eluato se lava, entonces, con agua, luego con solución saturada de NaCl, entonces se seca y se libra del disolvente. Quedan 2,34 g del compuesto indicado en el título como aceite incoloro.

3b) 5-Etil-6-(5,6,6-trifluor-hex-5-enil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ol

10

Una mezcla de 5,28 mmol 7,8,8-trifluoro-2-propionil-oct-7-enoato de metilo, 0,86g (10,2 mmol) de 3-amino-1,2,4-triazol y 10 ml de ácido propiónico se calienta aprox. 15 horas a reflujo. Entonces se destila el ácido propiónico y se purifica el residuo cromatográficamente sobre silicagel (mezcla de ciclohexano/éster acético). Quedan 0,6 g del
15 compuesto indicado en el título en forma de cristales amarillos.

3c) 7-Cloro-5-etil-6-(5,6,6-trifluor-hex-5-enil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

0,60 g (2mmol) del compuesto del Ejemplo 3b) en 20 ml de cloruro de fosforilo se calientan 15 horas a reflujo. Entonces se destilan los componentes volátiles, se absorbe el residuo en CH₂Cl₂, se lava la solución con solución de NaHCO₃ hasta neutralidad, se seca y se libra del disolvente. A partir del residuo se obtienen tras cromatografía sobre silicagel (mezcla de éster acético, metanol) 0,38 g del compuesto indicado en el título como aceite amarillo.

25

3d) 5-Etil-8-(5,6,6-trifluoro-hex-5-enil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina

Una solución de 0,35g (1,1mmol) del compuesto del Ejemplo 3c) en 2 ml de metanol se agita con 10ml de una solución metanólica 7M de NH₃ durante 48 horas a 20 a 25°C. La solución se libra de los componentes volátiles, el residuo se suspende con agua en el baño de ultrasonido, se filtra, y luego se seca. Quedan 0,21g del compuesto indicado en el título en forma de cristales blancos de p.f. 199°C.

Tabla I – Compuestos de la fórmula I

No.	R ¹	R ²	Datos físicos (p.f. [°C]; ¹ H-NMR δ [ppm])
I-1	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br	CH ₂ CH ₃	240-241
I-2	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₃	8,4 (s,1H), 7,8 (s,2H), 3,7 (t,2H), 2,8 (q, 2H), 2,7 (m,2H), 1,9 (m,2H), 1,2 (t,3H).
I-3	(CH ₂) ₅ CN	CH ₂ CH ₃	158 – 160
I-4	(CH ₂) ₆ CN	CH ₂ CH ₂ CH ₃	158
I-5	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	199
I-6	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH ₃	209-210
I-7	(CH ₂) ₄ CF=CF ₂	CH ₃	190-191

10

Ejemplos del efecto contra hongos nocivos

15 El efecto fungicida de los compuestos de la fórmula I puede ser ilustrada en los ensayos siguientes:

Los ingredientes activos se prepararon como solución madre con 25 mg de principio activo, que se completó con una mezcla de acetona y/o DMSO y el emulsionante Uni-

perok[®] 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 activo abajo

5 indicada

Ejemplo de aplicación 1 – Eficiencia con la peronospora de la vid causada por *Plasmopara viticola*

- 10 Las hojas de vid crecida en macetas se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa de la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente se inocularon los lados inversos de las hojas con una suspensión acuosa de esporangios de *Plasmopara viticola*. A continuación, se colocaron las plantas, primero, para 48 horas en una cámara saturada con vapor de agua 24°C y luego para 5 días en el invernadero a temperatura de 20 y 30°C. Después de este tiempo se colocaron las plantas para acelerar el desarrollo de los esporangios todavía para 16 horas en una cámara húmeda. Entonces se determinó visualmente el desarrollo de la infección en los lados inversos de las hojas.
- 15
- 20 En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm del compuesto I-7 estaban infectadas en 0%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta 90%.

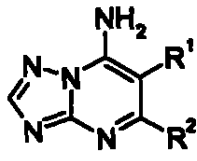
Ejemplo de aplicación 2: Actividad contra el mildiú en tomates causado *Phytophthora infestans* en el tratamiento protector

Las hojas de plantas de tomates en macetas se pulverizaron hasta chorrear con una
5 suspensión acuosa de la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día
siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporangios de
Phytophthora infestans. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada
con vapor de agua a temperaturas de 18 y 20°C. Después de 6 días se había
desarrollado el mildiú tan fuertemente en las plantas de control infectadas pero no
10 tratadas, que la infestación pudo ser determina visualmente en por cien.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm del compuesto I-7 estaban infectadas
en 0%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta 100%.

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



I

5 en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹ significa C₂-C₁₂-alquenilo o C₂-C₁₂-alquinilo, pudiendo las cadenas de carbono estar no sustituidas o llevar uno a tres grupos R^a y/o R^b iguales o diferentes;

10

o

C₁-C₁₄-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₈-alcoxi-C₂-C₁₂-alquenilo o C₁-C₈-alcoxi-C₂-C₁₂-alquinilo, llevando las cadenas de carbono uno a tres grupos R^a iguales o diferentes;

15

R^a es halógeno, ciano, nitró, hidroxilo, C₁-C₈-alquiltio, C₃-C₁₂-alqueniloxi, C₃-C₁₂-alquiniloxi, NR¹¹R¹², o

20

C₃-C₈-cilcoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos iguales o diferentes;

R^b es C_1-C_4 -alquilo, ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_3-C_6 -alqueniloxi, C_3-C_6 -alquiniloxi y $NR^{11}R^{12}$

R^{11} , R^{12} significan hidrógeno o C_1-C_6 -alquilo;

5

pudiendo las cadenas de carbono de los grupos R^a a su vez estar halogenadas;

10

R^2 es C_1-C_{12} -alquilo, C_1-C_{11} -alcoxi- C_1-C_{11} -alquilo, C_2-C_{12} -alquenil o C_2-C_{12} -alquinilo, estando las cadenas de carbono sustituidas por uno a tres grupos R^c

15

R^c es ciano, nitro, hidroxí, $NR^{11}R^{12}$ o C_3-C_6 -cilcoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos C_1-C_4 -alquilo iguales o diferentes, halógeno, ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_3-C_6 -alqueniloxi, C_3-C_6 -alquiniloxi, $NR^{11}R^{12}$.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde

20

R^1 C_1-C_{14} -halógenoalquilo, C_1-C_{12} -halógenoalcoxi- C_1-C_{12} -alquilo, C_1-C_{12} -alcoxi- C_1-C_{12} -halógenoalquilo, C_2-C_{12} -alquenilo, C_2-C_{12} -halógenoalquenilo, C_2-C_{12} -alquinilo o C_2-C_{12} -halógenoalquinilo, pudiendo las cadenas de carbono llevar uno a tres grupos R^a :

R^a es ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_8 -alcoxi, C_1-C_8 -alquiltio, C_3-C_{12} -alqueniloxi, C_3-C_{12} -alquiniloxi, $NR^{11}R^{12}$, o

5 C_3-C_8 -cicloalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos iguales o diferentes;

R^b es C_1-C_4 -alquilo, ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_8 -alcoxi, C_1-C_8 -alquiltio, C_3-C_8 -alqueniloxi, C_3-C_8 -alquiniloxi y $NR^{11}R^{12}$

10 R^{11} , R^{12} significan hidrógeno o C_1-C_8 -alquilo;

pudiendo las cadenas de carbono de los grupos R^a s su vez estar halogenadas;

15 3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde

R^1 significa C_2-C_{12} -alquilo, C_2-C_{12} -alquenilo o C_2-C_{12} -alquiltio, pudiendo las cadenas de carbono estar no sustituidas por uno a tres grupos R^c :

20 R^c ciano, nitro, hidroxí, $NR^{11}R^{12}$; o C_3-C_8 -cicloalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos C_1-C_4 -alquilo, halógeno, ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_8 -alcoxi, C_1-C_8 -alquiltio, C_3-C_8 -alqueniloxi, C_3-C_8 -alquiniloxi iguales o diferentes o $NR^{11}R^{12}$.

4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde

R^1 significa C_1 - C_{14} -alquilo, llevando las cadenas de carbono uno a tres grupos clano o halógeno iguales o diferentes

5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde

5

R^1 significa C_1 - C_{12} -alquenilo o C_1 - C_{12} -alquinilo, donde las cadenas de carbono están no sustituidas o llevan uno a tres grupos R^a y/o R^b iguales o diferentes

10 6. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, donde R^1 y R^2 presentan juntos, como máximo, 14 átomos de carbono.

7. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, donde R^1 significa clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, di-

15

fluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-tri-fluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo, 1-cloropropilo, 1-fluoropropilo, 3-cloropropilo, 3-fluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 1-clorobutilo, 1-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-fluorobutilo, 4,4,4-trifluorobutilo, 1-cloropentilo, 1-fluoropentilo, 5,5,5-trifluoropentilo, 5-cloropentilo, 5-fluoropentilo, 1-clorohexilo, 1-fluorohexilo, 6-clorohexilo, 6-fluorohexilo, 6,6,6-trifluorohexilo, 1-cloroheptilo, 1-fluoroheptilo, 7-cloroheptilo, 7-fluoroheptilo, 7,7,7-trifluoroheptilo, 1-clorooctilo, 1-fluorooctilo, 8-fluorooctilo, 8,8,8-trifluorooctilo, 1-clorononilo, 1-fluorononilo, 9-fluorononilo, 9,9,9-trifluorononilo, 9-clorononilo, 1-fluorodecilo, 1-

20

25

clorodecilo, 10-fluorodecilo, 10,10,10-trifluorodecilo, 10-clorodecilo, 1-cloro-undecilo, 1-fluoro-undecilo, 11-cloroundecilo, 11-fluoroundecilo, 11,11,11-trifluoroundecilo, 1-clorododecilo, 1-fluorododecilo, 12-clorododecilo, 12-fluorododecilo ó 12,12,12-trifluorododecilo.

5

8. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7, donde R² significa metilo, etilo, iso-propilo, n-propilo o n-butilo.

9. 6-(3-bromopropil)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

10 6-(3-cloropropil)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

6-(7-amino-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-6-il)-hexannitrilo;

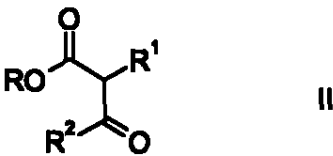
6-(7-amino-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-6-il)-hexannitrilo;

5-etil-6-hex-5-enil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

6-hex-5-enil-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

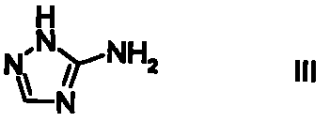
15 5-metil-6-(5,6,6-trifluor-hex-5-enil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina.

10. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque se transforman β-ceto ésteres de la fórmula II,



20

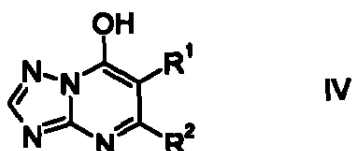
en la que R significa alquilo C₁-C₄, con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III



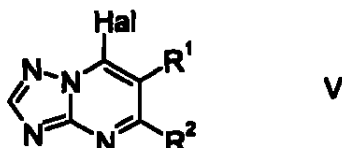
PF 55416

56

en 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV



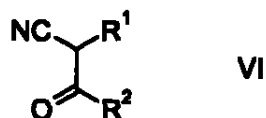
5 que se halogenan en compuestos de la fórmula V,



en la que Hal significa cloro o bromo, y se transforma V con amoníaco.

10

11. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque se transforman acilclanuros de la fórmula VI,



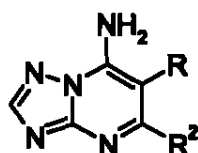
15 con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III según la reivindicación 8.

12. Compuestos de las fórmulas IV y V según la reivindicación 10.

13. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según la
20 reivindicación 1, en la que R¹ significa C₁-C₁₄-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-alquenilo o C₂-C₁₂-alquinilo sustituidos por halógeno, por halogenación de triazolopirimidinas de la fórmula VII,

PF 55416

57



VII

en la que R representa C₁-C₁₄-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-
 alquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, pudiendo las cadenas de carbono llevar uno a tres
 grupos R^a según la reivindicación 1, con un agente de halogenación en presen-
 5 cia de un iniciador de radicales libres o un ácido.

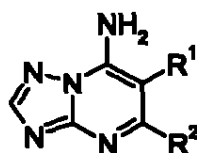
14. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de
 la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9.
- 10 15. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I según una de las reivindi-
 caciones 1 a 9 en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.
16. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se
 tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a
 15 la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fór-
 mula I según una de las reivindicaciones 1 a 9.

5,6-dialquil-7-amino-triazolopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

Resumen

5

5,6-Dialquil-7-amino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10

R¹ significa alquilo, alcoxialquilo, alquenilo o alquinilo;

R² significa alquilo, alcoxialquilo, alquenilo o alquinilo;

15 donde R¹ y/o R² pueden estar sustituidos en la forma indicada en la descripción;

procedimiento 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

124

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT
(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055416/N1	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002424	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08.03.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10.03.2004
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK INV. C07D487/04		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		
1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. ☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT). Diese Anlagen umfassen insgesamt 4 Blätter.		
3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: I ☒ Grundlage des Bescheids II ☐ Priorität III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 68.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 17.01.2006	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 12.07.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - Giltchiner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Hoepfner, W Tel. +49 30 25901-337 	

I. Grundlage des Berichts

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

Beschreibung, Seiten

1-36 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-16 eingegangen am 14.02.2006 mit Schreiben vom 13.02.2006

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

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

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

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

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

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

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

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

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

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
 - ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet.
 - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
 - ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☒ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist.
 - ☐ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
4. Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt:
- ☒ alle Teile.
 - ☐ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. beziehen.

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|------------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1,2,4-16 |
| | Nein: Ansprüche 3 |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1,2,4-16 |
| | Nein: Ansprüche 3 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-16 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen:
- siehe Beiblatt**

Zu Punkt IV**Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung**

Die europäische Patentanmeldung EP-A-0141317, eingereicht von der Anmelderin, offenbart fungizid wirksame 5,6-Dialkyltriazolopyrimidine (siehe Punkt V, Abschnitt "Neuheit").

Diese Verbindungen haben das selbe Strukturmerkmal gemeinsam wie die Verbindungen der Formel I des gegenwärtigen Anspruchs, nämlich Triazolopyrimidin, welches in 5- und 6-Stellung mit Alkyl substituiert ist.

Somit ist das Unterscheidungsmerkmal zwischen den gegenwärtigen Verbindungen der Formel I und den Verbindungen aus D1 zu sehen in der Liste der speziellen Substituenten der Gruppe R², nämlich

- Verbindungen der Formel I, bei denen gilt R^c=CN oder C₃-C₆-Cycloalkyl und
- Verbindungen der Formel I, bei denen gilt R^c=NO₂ oder OH.

Jedoch kann mit dem Vorhandensein von zwei verschiedenen Unterscheidungsmerkmalen gegenüber D1 und mit der Abwesenheit eines gemeinsamen Strukturmerkmals der Gegenstand des gegenwärtigen Anspruchs 1 nicht länger als einheitlich im Sinne von Regel 13 PCT angesehen werden und zerfällt demnach in zwei unterschiedliche Erfindungen (Nichteinheitlichkeit *a posteriori*), die wie folgt lauten:

- Bereitstellung von fungiziden Verbindungen der Formel I, bei denen gilt R^c=CN oder C₃-C₆-Cycloalkyl (erste Erfindung) und
- Bereitstellung von fungiziden Verbindungen der Formel I, bei denen gilt R^c=NO₂ oder OH (zweite Erfindung).

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

D1: EP-A-0 141 317 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15. Mai 1985 (1985-05-15)

D2: EP-A-0 215 382 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 25. März 1987 (1987-03-25)

Neuheit

Der Gegenstand des abhängigen Anspruchs 3 überlappt mit dem Gegenstand von D1, wobei der Überlappungsbereich in der Terminologie von D1 wie folgt definiert werden kann: A=Stickstoff, R¹=durch Halogen (F, Cl, Br) substituiertes Alkyl, R²=Alkyl, R³=H (vgl. Seite 1, Zeilen 4, 5; Seite 1, Formel I, Seite 1, Zeilen 23, 26, 32, 33; Seite 1, Zeilen 39-41; Seite 2, Zeile 7 - Seite 4, Zeile 9, Seite 10, Zeile 34 - Seite 11, Zeile 2).

Somit kann zum gegenwärtigen Zeitpunkt keine Neuheit anerkannt werden für den Gegenstand des abhängigen Anspruchs 3 sowie der folgenden Ansprüche 4-16, soweit sie sich auf Anspruch 3 beziehen.

Erfinderische Tätigkeit

Für den nicht vorweggenommenen Gegenstand der Ansprüche 1 und 2 sowie der Ansprüche 4-16, soweit sie sich nicht auf Anspruch 3 beziehen, können D1 und D2 (vgl. Seite 1, Spalte 2, Zeile 7 - Spalte 1, Zeile 34; Seite 1, Formel I; Seite 2, Spalte 2, Zeile 29-31) gleichermaßen als nächster Stand der Technik gelten, da sie die selbe Aufgabe lösen und beide strukturell der gegenwärtigen Formel I aus Anspruch 1 gleich nahe kommen.

Als Unterscheidungsmerkmale zwischen dem neuen Anspruchsgegenstand und D1 bzw. D2 kann das Vorhandensein gelten von

- Verbindungen der Formel I, bei denen gilt R^c=CN oder C₃-C₆-Cycloalkyl (erste Erfindung) und
- Verbindungen der Formel I, bei denen gilt R^c=NO₂ oder OH (zweite Erfindung).

In Abwesenheit von Beweismaterial für einen überraschenden technischen Effekt, der mit diesen Merkmalen in Zusammenhang steht, kann die dem neuen Anspruchsgegenstand zu Grunde liegende Aufgabe lediglich gesehen werden in der Bereitstellung weiterer fungizider Verbindungen sowie eines Verfahrens zu ihrer Herstellung.

Die beanspruchte Lösung dieser sehr allgemeinen Aufgabe bestand in der Modifizierung der aus D1 bzw. D2 bekannten Verbindungen durch Einführung eines weiteren Substituenten R^c ausgewählt aus

- CN oder C₃-C₆-Cycloalkyl (erste Erfindung) oder
- NO₂ oder OH (zweite Erfindung).

Da keine dieser Lösungen im Stand der Technik weder für sich genommen noch in Kombination entnommen vorschattiert war, muss für den neuen Anspruchsgegenstand das Vorhandensein von erfinderischer Tätigkeit anerkannt werden, selbst in Abwesenheit eines überraschenden technischen Effekts.

Gewerbliche Anwendbarkeit

Es besteht kein Zweifel, dass der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1-16 gewerblich anwendbar ist.

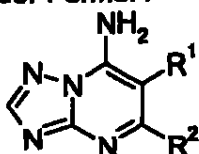
Formales

Die Ansprüche 1-16 basieren vollständig auf den ursprünglichen Ansprüchen 1-16 und sind daher zulässig unter Art. 19(2) und 34(2)(b) PCT.

Im abhängigen Anspruch 3 ist das Merkmal "R" fakultativ. Der Anspruch umfasst somit auch die Möglichkeit, dass R² keine weiteren Substituenten trägt. Damit geht der Schutzbereich von Anspruch 3 über den Schutzbereich des übergeordneten unabhängigen Anspruchs 1 hinaus.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



I

5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkynyl, wobei die Kohlenstoffketten unsubstituiert sind oder eine bis drei gleiche oder verschiedene Gruppen R^a und/oder R^b tragen;

10

oder

C₁-C₁₄-Alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₁₂-alkenyl oder C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₁₂-alkynyl, wobei die Kohlenstoffketten eine bis drei gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen;

15

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₃-C₁₂-Alkenyloxy, C₃-C₁₂-Alkinyloxy, oder

20

C₃-C₈-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^b tragen kann;

R^b C₁-C₄-Alkyl, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenyloxy und C₃-C₈-Alkinyloxy;

25

wobei die Kohlenstoffketten der Gruppen R^a ihrerseits halogeniert sein können;

R² C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkynyl, wobei die Kohlenstoffketten durch eine bis drei Gruppen R^c substituiert sind:

30

R^c Cyano, Nitro, Hydroxy; oder C₃-C₈-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen C₁-C₄-Alkyl, Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenyloxy oder C₃-C₈-Alkinyloxy tragen kann.

35

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin

R¹ C₁-C₁₄-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Halogenalkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-halogenalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Halogenalkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl o-

40

der C₂-C₁₂-Halogenalkinyl, wobei die Kohlenstoffketten eine bis drei Gruppen R^a tragen können:

5 R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₃-C₁₂-Alkenyloxy, C₃-C₁₂-Alkinyloxy, oder

C₃-C₈-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen tragen kann;

10 R^b C₁-C₄-Alkyl, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenyloxy und C₃-C₈-Alkinyloxy;

wobei die Kohlenstoffketten der Gruppen R^a ihrerseits halogeniert sein können;

15

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin

20 R² C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkynyl, wobei die Kohlenstoffketten durch eine bis drei Gruppen R^c substituiert sein können:

R^c Cyano, Nitro, Hydroxy; oder C₃-C₈-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen C₁-C₄-Alkyl, Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenyloxy oder C₃-C₈-Alkinyloxy tragen kann.

25

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, worin

R¹ C₁-C₁₄-Alkyl, wobei die Kohlenstoffketten eine bis drei gleiche oder verschiedene Gruppen Cyano oder Halogen tragen;

30

bedeutet

5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, worin

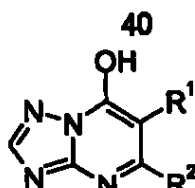
35 R¹ C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkynyl, wobei die Kohlenstoffketten unsubstituiert sind oder eine bis drei gleiche oder verschiedene Gruppen R^a und/oder R^b tragen;

bedeutet

40

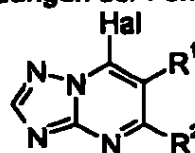
6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ und R² gemeinsam nicht mehr als 14 Kohlenstoffatome aufweisen.

7. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R¹ für
 Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluor-
 methyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl,
 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Tri-
 fluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl,
 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 1,1,1-Trifluorprop-2-yl, 1-Chlorpropyl,
 1-Fluorpropyl, 3-Chlorpropyl, 3-Fluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 1-Chlorbutyl,
 1-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Fluorbutyl, 4,4,4-Trifluorbutyl, 1-Chlorpentyl,
 1-Fluorpentyl, 5,5,5-Trifluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Fluorpentyl, 1-Chlorhexyl,
 1-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Fluorhexyl, 6,6,6-Trifluorhexyl, 1-Chlorheptyl,
 1-Fluorheptyl, 7-Chlorheptyl, 7-Fluorheptyl, 7,7,7-Trifluorheptyl, 1-Chloroctyl,
 1-Fluoroctyl, 8-Fluoroctyl, 8,8,8-Trifluoroctyl, 1-Chlomonyl, 1-Fluomonyl,
 9-Fluomonyl, 9,9,9-Trifluomonyl, 9-Chlomonyl, 1-Fluordecyl, 1-Chlordecyl,
 10-Fluordecyl, 10,10,10-Trifluordecyl, 10-Chlordecyl, 1-Chlorundecyl, 1-Fluor-
 undecyl, 11-Chlorundecyl, 11-Fluorundecyl, 11,11,11-Trifluorundecyl, 1-Chlor-
 dodecyl, 1-Fluordodecyl, 12-Chlordodecyl, 12-Fluordodecyl oder 12,12,12-
 Trifluordodecyl steht.
8. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, worin R² für
 Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl oder n-Butyl steht.
9. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1:
 6-(3-Brompropyl)-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 6-(3-Chlorpropyl)-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 6-(7-Amino-5-ethyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-6-yl)-hexannitril;
 6-(7-Amino-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-6-yl)-hexannitril;
 5-Ethyl-6-hex-5-enyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 6-Hex-5-enyl-5-methyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Methyl-6-(5,6,6-trifluor-hex-5-enyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin.
10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der An-
 sprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass man β -Ketoester der Formel II,
- $$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{RO}-\text{C}-\text{CH}(\text{R}^1)-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^2 \end{array} \quad \text{II}$$
- in der R für C₁-C₄-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III
- $$\begin{array}{c} \text{H} \\ \mid \\ \text{N} \quad \text{N} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{N} \quad \text{NH}_2 \end{array} \quad \text{III}$$
- zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV



IV

umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,

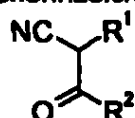


V

in der Hal für Chlor oder Brom steht, halogeniert werden, und V mit Ammoniak umgesetzt wird.

5

11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,



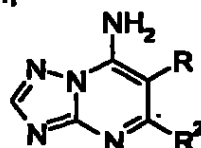
VI

- 10 mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III gemäß Anspruch 10 umgesetzt

12. Verbindungen der Formeln IV und V gemäß Anspruch 10.

13. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der R¹ durch Halogen substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkynyl bedeutet, durch Halogenierung von Triazolopyrimidinen der Formel VII,

15



VII

in der R für C₁-C₁₄-Alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl steht, wobei die Kohlenstoffketten eine bis drei Gruppen R^a gemäß Anspruch 1 tragen können, mit einem Halogenierungsmittel in Gegenwart eines Radikalstarters oder einer Säure.

20

14. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7.

25

15. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 9 in einer Menge von 1 bis 1000 g pro 100 kg.

30

16. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 9 behandelt.

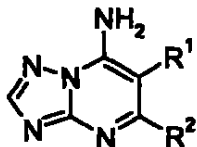
REIVINDICACIONES MODIFICADAS

PARA EFECTUAR

EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Reivindicaciones

- 5 1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 R^1 significa C_2 - C_{12} -alquenilo o C_2 - C_{12} -alquinilo, pudiendo las cadenas de carbono ser no sustituidas o llevar uno a tres grupos R^a y/o R^b iguales o diferentes;
- o
- 15 C_1 - C_{14} -alquilo, C_1 - C_{12} -alcoxi- C_1 - C_{12} -alquilo, C_1 - C_8 -alcoxi- C_2 - C_{12} -alquenilo o C_1 - C_8 -alcoxi- C_2 - C_{12} -alquinilo, llevando las cadenas de carbono uno a tres grupos R^a iguales o diferentes;
- 20 R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_1 - C_8 -alquiltio, C_3 - C_{12} -alquenilo, C_3 - C_{12} -alquinilo, o
- C_3 - C_8 -cilcoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos R^b iguales o diferentes;
- 25 R^b es C_1 - C_4 -alquilo, ciano, nitro, hidroxilo, C_1 - C_8 -alcoxi, C_1 - C_8 -alquiltio, C_3 - C_8 -alquenilo, C_3 - C_8 -alquinilo;

pudiendo las cadenas de carbono de los grupos R^a a su vez estar halogenadas;

5 R^2 es C_1-C_{12} -alquilo, C_2-C_{12} -alquenilo o C_2-C_{12} -alquinilo, estando las cadenas de carbono sustituidas por uno a tres grupos R^c

10 R^c es ciano, nitro, hidroxilo o C_3-C_8 -cilcoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos C_1-C_4 -alquilo iguales o diferentes, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_3-C_6 -alqueniloxi o C_3-C_6 -alquiniloxi.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde

15 R^1 C_1-C_{14} -halógenoalquilo, C_1-C_{12} -halógenoalcoxi- C_1-C_{12} -alquilo, C_1-C_{12} -alcoxi- C_1-C_{12} -halógenoalquilo, C_2-C_{12} -alquenilo, C_2-C_{12} -halógenoalquenilo, C_2-C_{12} -alquinilo o C_2-C_{12} -halógenoalquinilo, pudiendo las cadenas de carbono llevar uno a tres grupos R^a :

20 R^a es ciano, nitro, hidroxilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_3-C_{12} -alqueniloxi, C_3-C_{12} -alquiniloxi, o

C_3-C_8 -cilcoalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos iguales o diferentes;

R^b es C_1-C_4 -alquilo, ciano, nitro, hidroxilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_3-C_6 -alquenilo, C_3-C_6 -alquinoxio;

5 pudiendo las cadenas de carbono de los grupos R^a a su vez estar halogenadas.

3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde

10 R^1 significa C_2-C_{12} -alquilo, C_2-C_{12} -alqueno o C_2-C_{12} -alquino, pudiendo las cadenas de carbono estar no sustituidas por uno a tres grupos R^c :

R^c ciano, nitro, hidroxilo; o C_3-C_6 -cicloalquilo, que puede llevar uno a cuatro grupos C_1-C_4 -alquilo, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_3-C_6 -alquenilo, C_3-C_6 -alquinoxio iguales o diferentes.

15 4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde

R^1 significa C_1-C_{14} -alquilo, llevando las cadenas de carbono uno a tres grupos ciano o halógeno iguales o diferentes.

20 5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde

R^1 significa C_1-C_{12} -alqueno o C_1-C_{12} -alquino, donde las cadenas de carbono están no sustituidas o llevan uno a tres grupos R^a y/o R^b iguales o diferentes.

6. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, donde R¹ y R² presentan juntos, como máximo, 14 átomos de carbono.
7. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, donde R¹ significa 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, 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo, 1-cloropropilo, 1-fluoropropilo, 3-cloropropilo, 3-fluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 1-clorobutilo, 1-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-fluorobutilo, 4,4,4-trifluorobutilo, 1-cloropentilo, 1-fluoropentilo, 5,5,5-trifluoropentilo, 5-cloropentilo, 5-fluoropentilo, 1-clorohexilo, 1-fluorohexilo, 6-clorohexilo, 6-fluorohexilo, 6,6,6-trifluorohexilo, 1-cloroheptilo, 1-fluoroheptilo, 7-cloroheptilo, 7-fluoroheptilo, 7,7,7-trifluoroheptilo, 1-clorooctilo, 1-fluorooctilo, 8-fluorooctilo, 8,8,8-trifluorooctilo, 1-clorononilo, 1-fluorononilo, 9-fluorononilo, 9,9,9-trifluorononilo, 9-clorononilo, 1-fluorodecilo, 1-clorodecilo, 10-fluorodecilo, 10,10,10-trifluorodecilo, 10-clorodecilo, 1-cloro-undecilo, 1-fluoro-undecilo, 11-cloroundecilo, 11-fluoroundecilo, 11,11,11-trifluoroundecilo, 1-clorododecilo, 1-fluorododecilo, 12-clorododecilo, 12-fluorododecilo ó 12,12,12-trifluorododecilo.
8. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7, donde R² significa metilo, etilo, iso-propilo, n-propilo o n-butilo.

9. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1:

6-(3-bromopropil)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

6-(3-cloropropil)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

6-(7-amino-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-6-il)-hexannitrilo;

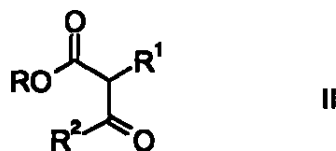
5 6-(7-amino-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-6-il)-hexannitrilo;

5-etil-6-hex-5-enil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

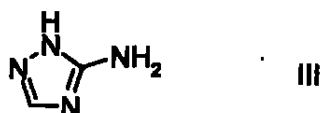
6-hex-5-enil-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

5-metil-6-(5,6,6-trifluor-hex-5-enil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina.

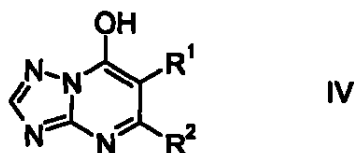
10 10. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque se transforman β-ceto ésteres de la fórmula II,



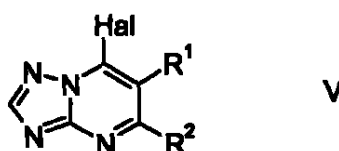
15 en la que R significa alquilo C₁-C₄, con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III



en 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV

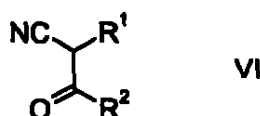


20 que se halogenan en compuestos de la fórmula V,



en la que Hal significa cloro o bromo, y se transforma V con amoníaco.

- 5 11. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque se transforman acilcianuros de la fórmula VI,



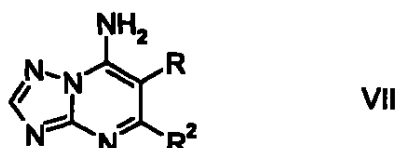
con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III según la reivindicación 10.

10

12. Compuestos de las fórmulas IV y V según la reivindicación 10.

13. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en la que R¹ significa C₁-C₁₄-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-alquenilo o C₂-C₁₂-alquinilo sustituidos por halógeno, por halogenación de triazolopirimidinas de la fórmula VII,

15



en la que R representa C₁-C₁₄-alquilo, C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-alquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, pudiendo las cadenas de carbono llevar uno a tres grupos R^a según la reivindicación 1, con un agente de halogenación en presencia de un iniciador de radicales libres o un ácido.

20

14. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7.
- 5 15. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9 en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.
- 10 16. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 9.



FORMATO DE DIGITALIZACI N
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Software Development S. de RL

142

Expediente No		06-088722	No de Follo
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	X	1
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:

contiene arte final

144
143

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-088722- -00000-0000
Fec: 2008-08-05 17:05:15 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 379 FASENACIONALII
An 411 REPRESENTACION Folio: 144

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 63,962
FECHA : AGOSTO 22 DE 2008

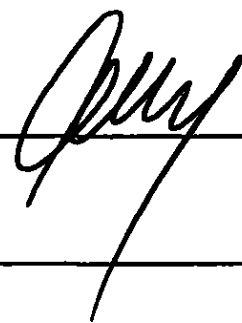
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	49368279	22/08/2008	42,102,000.00

***** CONCEPTO *****

Nº.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
		TOTAL :	\$ 463,000.00

SGN: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Go 00361-841-130-4

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

PATENTE DE INVENCION

[1]

MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente [X]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [X]
- ◆ Descripción de la invención [X]
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [X]

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha **05 SET. 2008**

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@slc.gov.co
www.slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Folio 146

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	06 88722
	Solicitud internacional	EP2005/002424
	Fecha inicio fase nacional	10/10/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	1512
	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,

10 OCT. 2006

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpall