Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** 06-90485

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** A01N 43/90

71. **SOLICITANTE** BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. **APODERADO** EMILIO FERRERO
C.C. 430.019 de Usaquén

22. **BOGOTÁ, D. C.,**

Publicación
Fe. 10-10-2006

(FORMA P-10)

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-090465- -00000-0000
Fec: 2006-09-08 17:13:04 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios: 85

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE: (1)

☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ Capítulo I. ☒ Capítulo II.

(2) SOLICITANTE (71)

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

Dirección: 67056 Ludwigshafen, República Federal de Alemania

Domicilio: Ludwigshafen, República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN
C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual ____
Número ____

(3) REPRESENTANTE O APODERADO

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

IDENTIFICACIÓN
C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual ____
Número 438.019 T.P 31.929

(4) INVENTOR (ES) (72)

1. **Jordi TORMO I BLASCO**
   Carl-Benz-Strasse.10-3,
   69514 Laudenbach,
   República Federal de Alemania
2. **Carsten BLETTNER**
   Richard-Wagner-Strasse.48,
   68165 Mannheim,
   República Federal de Alemania
3. **Bernd MÜLLER**
   Stockinger Strasse. 7,
   67227 Frankenthal,
   República Federal de Alemania
4. **Markus GEWEHR**
   Goethestrasse. 21,
   56288 Kastellaun,
   República Federal de Alemania
5. **Wassilios GRAMMENOS**
   Alexander-Fleming-Strasse. 13,
   67071 Ludwigshafen,
   República Federal de Alemania
6. **Thomas GROTE**
   Im Höhnhausen 18,
   67157 Wachenheim,
   República Federal de Alemania
7. **Joachim RHEINHEIMER**
   Merziger Strasse.24,
   67063 Ludwigshafen,
   República Federal de Alemania
9. **Frank SCHIEWECK**
   Lindenweg 4,
   67258 Hessheim,
   República Federal de Alemania
10. **Anja SCHWÖGLER**
    Heinrich-Lanz-Strasse. 3,
    68165 Mannheim
    República Federal de Alemania
11. **Oliver WAGNER**
    Im Meisental 50,
    67433 Neustadt
    República federal de Alemania
12. **Matthias NIEDENBRÜCK**
    Albert-Einstein-Alle 3,
    67117 Limburgerhof
    República Federal de Alemania
13. **Maria SCHERER**
    Hermann-Jürgens-Strasse.30,
    76829 Godramstein
    República Federal de Alemania
14. **Siegfried STRATHMANN**
    Donnersbergstrasse. 9,
    67117 Limburgerhof
    República Federal de Alemania
15. **Ulrich SCHÖFL**
    Erlenstrasse. 8,
    68782 Brühl,
    República Federal de Alemania

	8. Peter SCHÄFER Römerstrasse. 1, 67308 Ottersheim República Federal de Alemania
	16. Reinhard STIERL Jahnstrasse.8, 67251 Freinsheim, República Federal de Alemania

5 **PCT (86)**
Solicitud Internacional No. PCT/EP/2005/002426 Fecha: 8 de marzo de 2005
Publicación Internacional No. WO 2005/087772 A1 Fecha: 22 de Septiembre de 2005

6 TÍTULO (54) **5,6 DIALQUIL –7- AMINO-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACIÓN Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN**

7 **Clasificación Internacional (51)** C07D 487/04 A01N 43/90

8 **Prioridad**	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
SI☒ NO☐	DE	10 de marzo de 2004	102004012018.8

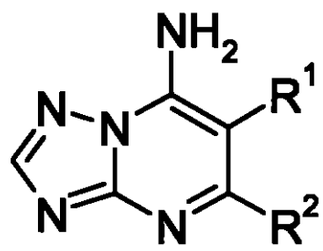
9 **Comprobante de pago No.:** 06-63.963 **Fecha:** Agosto 22 de 2006

10 **Anexos:**

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por $ 463.000.oo.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



I

12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA : _____

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional

   Descripción:

   Páginas 21 en el idioma original

   Páginas 32 en español

   Reivindicaciones: 10 Número (s)

   Figuras: Número (s)

2. ☒ Traducción de los anexo del Examen Preliminar Internacional sobre Patentabilidad

3. ☒ Extracto de publicación.

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional

   Descripción:

   Páginas 21 en el idioma original

   Páginas 32 en español

   Reivindicaciones: 10 Número (s)

   Figuras: Número (s)

2. ☒ Traducción de los anexo 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

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

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República Federal de Alemania

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929; domiciliados en la Carrera 4ª Nº 72-35, Bogotá, Colombia, en obedecimiento a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.
Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo(amos) a los dichos apoderados para que me(nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y enseñas; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos hechos por agentes oficiosos.

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de) .....
BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª Nº 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 Verterter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmägtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen 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 Beamter, oder Kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Gennanten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendeten, einer oder anderen, ordnungsweise werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.
Ausserdem, und unter dieselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwaelte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentum zuerhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb: zu dessem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtssprechung 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-, Sammel-, Defensive- und Service-zeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen- und zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Names-und-Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragslizenz; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmassnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt; und c) damit die in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, abtreten, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmägtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am 17. März 1989

in D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

Firma — Unterschrift

ppa. Welzel — ppa. Richters

GENERAL DE COL

U.R.Nr. 1407/89

Ich beglaubige hiermit die Echtheit der vorste[illegible], 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 bescheinige 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 beigedrückten 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)

Präsident des Landgerichts Frankenthal (Pfalz)

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA
COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

6

CONSULADO ENERAL DE C L MBIA

№ - 0077

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 Regional de Frankenthal (Pfalz)----------
que la compañia BASF Aktiengesellschaft----------
es una sociedad constituída 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) representante(s) legal(es) en este país.

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

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

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 AGO 2006
MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

Frankfurt a. M 06 ABR 1989

№ - 0077

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE
Son $ US. 6.- de los E.E.U.U.

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA FRANKFURT/M.

Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Bogotá ... 85001

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

28 AGO 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

7

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

28 AGO 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

Die konsularische Legalisierug 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.

FRANKFURT/M.

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

28 AGO 2000

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

8

LA ... INSTRUCCIONES ... RECUERDE QUE TODOS LOS ... DEBEN ESTAR DILIGENC... CON ALGUN VALOR; ... CERO (0)

881051599954

B C C 16
SUCURSAL CORPORATIVA

DECLARACION Y PA...
IMPUESTO D...
TIMBR...
NACION...

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

① Administración de Impuestos de: BOGOTA		Código 0 3	② Teléfono 2120100
③ Documento de Identificación (marque X) C.C. ó T.I. [C] NIT. [A] [X] No. 860041367	D.V. 3	④ Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres). CAVELIER ABOGADOS	
⑤ C.C. ó T.I. [C] [X] NIT. [A] No. 19' 301.629	D.V.	⑥ Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres). FORERO ROCHA JAIME	
⑦ Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4) Cra. 4a. No. 72-35	Municipio BOGOTA	Departamento CUNDINAMARCA	⑧ Número documentos timbrados. 1

⑨ Relaciones ... número, fecha, valor y naturaleza de la transacción

TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989

PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER

COLO 0361-52-218-8

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

28 ... 2006

JUAN MANUEL ... MEDINA
NOTARIO

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

Responsable del pago

Nombre
C.C. No. 19301625

1 VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR	VP	750
2 Sanciones	VS	
3 Intereses de mora	IM	
4 TOTAL A PAGAR (sanciones ... 3)	TP	750
5 750		

CORPORATIVA

1 037 *** 750.00

CON PAGO

DEM-31-V-88

CONTRIBUYENTE

MH 1880/88

TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

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

---

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

LUZ ANRIAGA DE HERBEK
TRADUCTORA INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. 599 Ministerio

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 r s , químico, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 AGO 2008
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona.

10

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr. Siegfried Kohler
Notario de Ludwigshafen

Fdo.: firma ilegible
Th. Walter
Asesor del notario como representante oficialmente designado del notario Dr. Siegfried Kohler

LUZ ARRIAGA DE HERRERA
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. 596 Minjusticia

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 eel mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

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

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA
COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 AGO 2008
JUAN SAMUEL NOTERO MEDINA
NOTARIO

11

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 Esteriores de Colombia bajo el No. 85061 del 24 de abril de 1989.

Pagado impuesto de timbre US$ 6;oo

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

Resolución No. 5[illegible] SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

28 AGO 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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

Luz Arriaga de Herben

IDENTIFICADO CON C.C. NO.(S) [illegible]

05 AGO. 1999

SANTAFE DE BOGOTA

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 28 ABR. 1989 No. 89045
HACE CONSTAR
Que el señor
Luz de Herrera
cuya firma aparece al pie del presente documento, desempeñaba en esa fecha las funciones allí indicadas.

COMO NOTARIO SEXTO-SEMIÉRCULO DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 AGO 2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

...ACUÑA
... Generales
División Consular
Encargado

12

CAVELIER
ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO (57) (1) 2120100
CABLES: CAVELEYES

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

Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

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

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

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER
T.P.A. No. 832
C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 AGO 200
Aceptor: EL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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 2282 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá comparecio, el Doctor Emilio [illegible]

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 429.[illegible] expedida en Ubaque y la tarjeta profesional número 31.929 del Ministerio de Justicia, con el presente documento dirigido a: D.D. Huertas (Rotaciones) y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

Santafé de Bogotá, D. C. - 6 OCT. 1993

AUTORIZO LA ANTERIOR

República de Colombia Notaría [illegible] Círculo [illegible] Diag. [illegible] No. [illegible] Armando Palomino [illegible]

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL
(Art. 1ro. del Decreto 2282 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá comparecio, el Doctor Germán Davilier Gaviria

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 2077924 expedida en [illegible] y la tarjeta profesional número 837 del Ministerio de Justicia, con el presente documento dirigido a: División Nuevos Creadores y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

Santafé de Bogotá, D. C. 01 OCT. 1993

AUTORIZO LA ANTERIOR

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 AGO 2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

[illegible] de Bogotá D.C. Diag. [illegible] Germán Vargas Espinosa

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

2031 13

Colombia

0000055414

CESION

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

domiciliado(s) en

ASSIGNMENT

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

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 Schöfl
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
Reinhard Stierl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s) inventor(es) de la invención: 5-6 Dialkyl-7-amino Triazolopirimidinas, 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(erimos), sin limitación, a favor de la sociedad

BASF Aktiengesellschaft

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

Alemania

a corporation constituted and existing in conformity with the laws of

Germany

domiciliada en

67056 Ludwigshafen, Alemania

domiciled in

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.

CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

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

Firma Signature

Jordi Tormo i Blasco

Carsten Blettner

Bernd Müller

Markus Gewehr

Wassilios Grammenos

Thomas Grote

Joachim Rheinheimer

Peter Schäfer

Frank Schieweck

Anja Schwögler

Oliver Wagner

Matthias Niedenbrück

Maria Scherer

Siegfried Strathmann

Ulrich Schöfl

Reinhard Stierl

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

17

U.R.Nr. 409/2005

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 **Tormo 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 **Schwögler**, 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.

are true and valid.

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

Notar

Wert: 5.112,92 Euro

~~20~~
19

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. 11532

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 Tormo i Blasco
domiciliado en Carl-Benz-Str: 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania
Ciudadano de España
Carsten Blettner
domiciliado en Richard- Wagner-Str: 48, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
Bernd Müller
domiciliado en Stockingerstr.7, 67227 Frartkenthal,Alemania
Ciudadano de Alemania
Markus Gewehr
domiciliado en Goethestraβe 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
domicillado en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania
Ciudadano de Alemania
Anja Schwögler
domiciliada en Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania
Ciudadana de Alemania

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 Schöfl
domiciliado en Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania
Ciudadano de Alemania
Reinhard Stierl
domiciliado en Jahnstr: 8, 67251 Freinsheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

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

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 dieciséis firmas ilegibles de los mencionados señores. Dado y firmado el 24 de febrero de 2005.

Sigue: Autenticación notarial en inglés de las dieciséis firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 24 de febrero de 2005, bajo U.R. No. 409/2005. (Hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

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

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, 12 de agosto de 2006
C. 2927

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

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

Luz Arriaga de Herber

...LA FIRMA REGISTRADA POR ...) EN ESTA NOTARIA

23 AGO 2006

NOTARIA SEXTA
PABLO MENDEZ
CARAJAS
Notario Sexto Encargado

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 AGO 23 P 1:06

JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

4 8 0 2 0 2

CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

TRADUCCIÓN OFICIAL No.06.331 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 e intérprete oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y autorizada por el Ministerio del Interior y Justicia, por Resolución No. 323 de 1980 (Se traduce un documento de Cesión de inventores a favor de BASF AKTIENGESELLSCHAFT con Apostilla en Alemán No. 91 Eb-309-317/05).

DOCUMENTO DE CESION

De inventores a favor de BASF AKTIENGESELLSCHAFT, sociedad constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania, domiciliada en 6708 Ludwigschafen, Alemania, de la invención: 5,6-Dialkyl-7-amino Triazolo Pyrimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen.

U.R. Nr. 409/2005

Yo, Ludwig Draxel-Fischer, Notario Público de Ludwigs-hafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente certifico y confirmo las firmas de las siguientes personas, a quienes conozco personalmente:

1. Sr. Jordi **Tormo I Blasco**, residente en Carl-Benz-Str. 10-3, 69514, Laudenbach, Alemania, Ciudadano español.
2. Sr. Carsten **Bllettner**, residente en Richard-Wagner-Str/48. 68165, Mannheim, Alemania.
3. Sr. Bernd **Müller**, residente en Stockinger Str., 7, 67227 Frankenthal, Alemania.
4. Sr. Markus **Gewehr**, residente en Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Alemania.

5. Massilios **rammenos**, residente en Alexander-Fleming-Str., 13, 67071, Ludwigshafen, Alemania, Ciudadano de Grecia,
6. Sr. Thomas **Grote**, residente Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania
7. Sr. Joachim **Rheinheimer**, residente en Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania.
8. Sr. Peter **Schäfer**.residente en Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Alemania;
9. Sr. Frank **Schieweck**, residente en Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania;
10. Sra. Anja **Swchögler**, residente en Heinrich-Lanz-Str 3, 68165, Mannheim, Alemania ;
11. Sr. Oliver **Wagner**, residente Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania;
12. Sr.Matthias **Niedenbrûck**, residente en Albert Einstein-Alle 3, 67117 Limburgerhof, Alemania;
13. Sra. Maria **Scherer**, residente en Hermann-Jûrgens-Str. 30 76829, Godramstein, Alemania
14. Sr. Siegfried **Strathmann**, residente en Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania;
15. Sr. Ulrich **Schôfl**, residiente en Erlenstr. 8, 68782 Brûhl, Alemania,
16. Sr. Reinhard **Stierl**, residente en Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania

RADUCCION OFICIAL No. 06-331
HILDA AGUILERA DE PIEDRAHITA
INTERPRETE OFICIAL
RES No 323 DEL MIN. DE JUSTICIA

Apostilla en Alemán No. 91 Eb-309-317/05

Son verdaderas y válidas

Ludwigishafen/Rhine, hoy día 24 de Febrero, 2005.

(Firma) en Rúbrica

Notario Público

WERT: 5.112, 92 Euro

Es traducción fiel de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación y a la cual me remito habiendo tenido el original a la vista,

Agosto 14, 2005.crts. 2,476

Solic. ZCA Colo- 261-841-127-0

TRADUCCION OFICIAL No. 06331
HILDA AGUILERA DE PIEDRAHITA
INTERPRETE OFICIAL
RES. No. 323 DEL MIN. DE JUSTICIA

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

COTA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DESEMPEÑA LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 SEP -6 A 11:43

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

COTA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DESEMPEÑA LAS FUNCIONES INDICADAS

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

27
26

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
22. September 2005 (22.09.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/087772 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 487/04, A01N 43/90 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/002426

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

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102004012018.8 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). BLETTNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wagner-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, Wassilios [GR/DE]; Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhnhausen 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]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE]; Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE). NIEDENBRÜCK, Matthias [DE/DE]; Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof (DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlanstr. 8, 68782 Brühl (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251 Freinsheim (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.

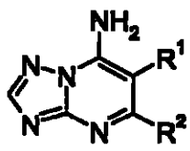
(84) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, 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:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes 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 IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(I)

(57) Abstract: The invention relates to 5,6-dialkyl-7-amino-triazolopyrimidines of formula (I), in which the substituents are defined as follows: R^1 represents alkyl, alkoxymethylene or alkoxyethylene, whereby the aliphatic groups can be substituted according to the description and R^2 represents n-propyl or n-butyl. 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, Alkoxymethylen oder Alkoxyethylen, wobei die aliphatischen Gruppen gemäß der Beschreibung substituiert sein können; R2 n-Propyl oder n-Butyl; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

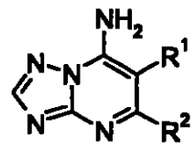
WO 2005/087772 A1

2931 ~~28~~ 27

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines, method for their production, their use for controlling pathogenic fungi, and agents containing said compounds

Description

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



I

in which the substituents are as defined below:

R^1 is C_5-C_9-alkyl, C_4-C_{11}-alkoxymethylene or C_3-C_{10}-alkoxyethylene, where the aliphatic groups may be substituted by 1 to 3 of the following groups:

cyano, nitro, hydroxyl, C_3-C_6-cycloalkyl, C_1-C_6-alkylthio, C_5-C_{12}-alkynyl and NR^aR^b;

R^a, R^b are hydrogen or C_1-C_6-alkyl;

R^2 is n-propyl or n-butyl.

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

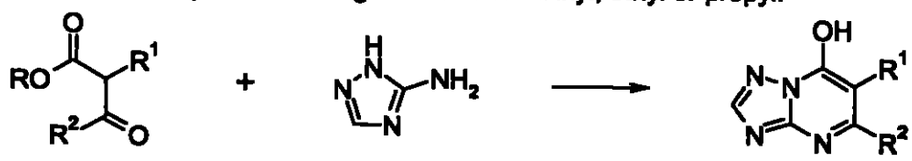
5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines are proposed in a general manner in GB 1 148 629. Individual fungicidally active 5,6-dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines are known from EP-A 141 317. However, in many cases their activity is unsatisfactory. Based on this, it is an object of the present invention 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 5-position of the triazolopyrimidine skeleton.

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

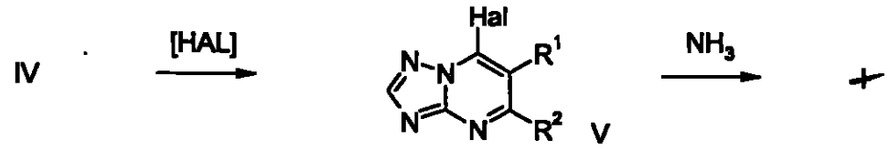
The compounds according to the invention can be obtained by different routes. Advantageously, the compounds according to the invention are obtained by converting substituted β-ketoesters of the formula II with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula 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.



II III IV

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, dibutylformamide, N,N-dimethylacetamide, lower alkanoic 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, triisopropylethylamine, 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 as 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 triisopropylethylamine, 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.

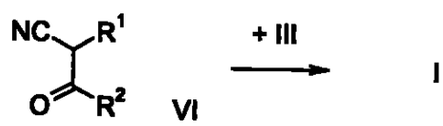


In most cases, the resulting condensates of the formula IV precipitate from the reaction solutions in pure form and, after washing with the same solvent or with water and subsequent drying they are reacted with halogenating agents, in particular chlorinating or brominating agents, to give the compounds 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. The 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 alkanoic 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.

~~31~~ 30

The novel 7-aminotriazolo[1,5-a]pyrimidines are, if appropriate after evaporation of the solvent or dilution with water, isolated as crystalline compound.

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 alkoxides, alkali metal amides or metal alkyls (cf.: J. Amer. Chem. Soc. 73, (1951), p. 3766).

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 in the treatment of plants in the treated plants, or in the harmful fungus to be controlled.

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;

alkyl: saturated straight-chain or mono- or dibranched hydrocarbon radicals having 1 to 4 or 5 to 9 carbon atoms, for example C_1-C_6-alkyl such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, n-pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl;

halomethyl: a methyl group in which some or all of the hydrogen atoms may be replaced by halogen atoms as mentioned above; in particular chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl;

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

Alkoxymethylene and alkoxyethylene: a saturated straight-chain or mono-, di- or tribranched hydrocarbon chain which is attached via a methyleneoxy group and

ethyleneoxy group, respectively, for example a hydrocarbon chain described above having 3 to 11 carbon atoms, 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-trimethyl-pentyloxy)propyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)propyl.

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

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 R^1 has at most 9 carbon atoms.

The alkyl groups in R^1 in formula I are preferably straight-chain or mono-, di- or tribranched alkyl groups, the alkyl groups preferably bearing no substituents.

In addition, preference is given to compounds of the formula I which, in R^1, are branched at the α carbon atom. They are described by formula Ia:

Ia

in which R^{11} is C_3-C_{10}-alkyl or C_5-C_{10}-alkoxyalkyl and R^{12} is C_1-C_4-alkyl, in particular methyl, where R^{11} and R^{12} together have at most 12 carbon atoms and are unsubstituted or may be substituted like R^1 in formula I.

If R^1 is an alkyl group substituted by cyano, the cyano group is preferably located at the terminal carbon atom.

In one embodiment of the compounds I according to the invention, R^1 is C_5-C_9-alkyl or C_4-C_{11}-alkoxymethylene or C_3-C_{10}-alkoxyethylene. For these groups C_4-C_{10}-alkoxy chains are preferred.

Particular preference is given to compounds I in which R^1 is n-pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, n-hexyl, 1,1-dimethyl-propyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methyl-pentyl, 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 or 1-ethyl-2-methylpropyl.

In addition, preference is given to compounds of the formula I in which R^1 is n-heptyl, 1-methylhexyl, n-octyl, 1-methylheptyl, n-nonyl, 1-methyloctyl and 3,5,5-trimethylhexyl.

In one embodiment of the compounds I according to the invention, R^2 is n-propyl.

In a further embodiment of the compounds I according to the invention, R^2 is n-butyl.

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

Table 1
Compounds of the formula I in which R^1 for each compound corresponds to one row of Table A and R^2 is n-propyl

Table 2
Compounds of the formula I in which R^1 for each compound corresponds to one row of Table A and R^2 is n-butyl

Table A

No.	R^1
A-1	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-2	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-3	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-4	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-5	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-6	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_3$
A-7	$CH(CH_3)CH(CH_3)_2$
A-8	$CH_2C(CH_3)_3$
A-9	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-10	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-11	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-12	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$

No.	R^1
A-13	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2CH_2$
A-14	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-15	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-16	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-17	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-18	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-19	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-20	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-21	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-22	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-23	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-24	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-25	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-26	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-27	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-28	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-29	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-30	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-31	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-32	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-33	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-34	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-35	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-36	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-37	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-38	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-39	$CH_2CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-40	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-41	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-42	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_3$
A-43	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-44	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$

35
34

No.	R^1
A-45	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-46	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-47	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-48	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-49	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-50	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-51	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-52	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-53	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-54	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-55	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-56	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_3$
A-57	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-58	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-59	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-60	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-61	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)_3$
A-62	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-63	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-64	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-65	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-66	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-67	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-68	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-69	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-70	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-71	$CH_2\text{-}O\text{-}C(CH_3)_3$
A-72	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2C(CH_3)_3$
A-73	$CH_2\text{-}O\text{-}CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-74	$CH_2\text{-}O\text{-}CH(CH_2CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-75	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-76	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH(CH_2CH_3)CH_2CH_2CH_3$

~~36~~ 35

No.	R^1
A-77	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-78	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-79	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-80	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-81	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_3$
A-82	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-83	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-84	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-85	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-86	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-87	CH_2CH_2-O-$CH(CH_3)_2$
A-88	CH_2CH_2-O-$C(CH_3)_3$
A-89	CH_2CH_2-O-$CH_2C(CH_3)_3$
A-90	CH_2CH_2-O-$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-91	CH_2CH_2-O-$CH(CH_2CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-92	CH_2CH_2-O-$CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-93	CH_2CH_2-O-$CH_2CH(CH_2CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-94	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-95	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-96	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-97	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$

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

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

They are especially suitable for controlling the following plant diseases:

37
36

- *Alternaria* species on fruit and vegetables,
- *Bipolaris* and *Drechslera* species on cereals, rice and lawns,
- *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
- *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamental plants and grapevines,
- *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,
- *Peronospora* species on cabbage and onion plants,
- *Phakopsora pachyrhizi* and *P. meibomiae* on soybeans,
- *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
- *Phytophthora capsici* on paprika,
- *Plasmopara viticola* on grapevines,
- *Podosphaera leucotricha* on apples,
- *Pseudocercosporella herpotrichoides* on wheat and barley,
- *Pseudoperonospora* species on hops and cucumbers,
- *Puccinia* species on cereals,
- *Pyricularia oryzae* on rice,
- *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
- *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.

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.

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

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

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.

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.

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

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

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

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

Suitable surfactants are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutylnaphthalenesulfonic 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 ethers, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ethers, tristearylphenyl polyglycol ethers, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty

alcohol/ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil, polyoxyethylene alkyl ethers, ethoxylated polyoxypropylene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

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

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

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

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

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

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

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

C Emulsifiable concentrates (EC)
15 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene

with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5%). Dilution with water gives an emulsion.

D Emulsions (EW, EO)

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

E Suspensions (SC, OD)

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

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

H Dustable powders (DP)

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

I Granules (GR, FG, GG, MG)

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

J ULV solutions (UL)

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

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.

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. 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%.

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

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

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

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

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,

- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamine or tridemorph,
- anilinopyrimidines, such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyprodinyl,
- antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,
- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinitroconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, ipconazole, metconazole, 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,
- heterocyclic compounds, such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, picobenzamide, probenazole, proquinazid, pyrifenox, pyroquilon, quinoxyfen, silthiofam, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole or triforine,
- copper fungicides, such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride or basic copper sulfate,
- nitrophenyl derivatives, such as binapacryl, dinocap, dinobuton or nitrophthal-isopropyl,
- phenylpyrroles, such as fenpiclonil or fludioxonil,
- sulfur,
- other fungicides, such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, diclomezine, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, phosporous acid, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenone, pencycuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-methyl, quintozene or zoxamide,
- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- sulfenic acid derivatives, such as captafol, captan, dichlofluanid, folpet or tolylfluanid,
- cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

Synthesis examples

The procedures described in the following synthesis examples were used to prepare further compounds I by appropriate modification of the starting materials. The compounds thus obtained are listed in the table below, together with physical data.

Example 1: Preparation of 5-cyanododecan-4-one

At -70°C, a solution of 0.495 mol of butyllithium in hexane was added to a solution of 0.45 mol of decanitrile in 300 ml of tetrahydrofuran (THF), the mixture was stirred at this temperature for about 3 hours and 0.45 mol of ethyl butanoate was then added. The mixture was subsequently stirred at 20-25°C for about 16 hours, 200 ml of water were then added and the mixture was acidified with dil. HCl solution. After the phases had separated, the organic phase was removed, washed with water, dried and freed from the solvent. 71 g of the title compound remained.

Example 2: Preparation of 7-amino-5-n-propyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine

A mixture of in each case 1.27 mol of 5-cyanododecan-3-one from Example 1 and 3-amino-1,2,4-triazole and 0.25 mol of p-toluenesulfonic acid in 900 ml of mesitylene was heated at 170°C for about 4 hours. After cooling to about 20-25°C, the precipitate was filtered off and then taken up in dichloromethane. After washing with water and drying, the solvent was distilled off from the solution, giving, as residue, 102 g of the title compound of m.p. 165°C.

Table I – Compounds of the formula I

No.	R^1	R^2	Phys. data (m.p. [°C])
I-1	$CH(CH_3)(CH_2)_5CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	145
I-2	$(CH_2)_7CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	165
I-3	$CH(CH_3)(CH_2)_5CH_3$	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	116
I-4	$(CH_2)_7CH_3$	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	145
I-5	$(CH_2)_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	$CH_2CH_2CH_3$	185
I-6	$(CH_2)_5CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	174-175
I-7	$(CH_2)_8CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	169-170
I-8	$(CH_2)_{10}CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	138-139
I-9	$(CH_2)_5CN$	$CH_2CH_2CH_3$	158

Examples of the action against harmful fungi

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

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

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 sporangiospore suspension of *Plasmopara viticola*. The vines were then initially placed in a water-vapor-saturated chamber at 24°C for 48 hours and then in a greenhouse at temperatures between 20°C 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 sporangiospores. The extent of the development of the infection on the undersides of the leaves was then determined visually.

In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of the compounds I-1, I-2, I-3, I-4, 1-6 or 1-7 showed no more than 10% infection, whereas the untreated plants were 90% infected.

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 having the concentration of active compounds stated below. The next day, the leaves were infected with an aqueous sporangiospore suspension of *Phytophthora infestans*. The plants were then placed in a water-vapor-saturated chamber at temperatures between 18 and 20°C. After 6 days, the late blight on the untreated, but infected control plants had developed to such an extent that the infection could be determined visually in %.

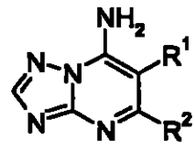
In this test, the plants which had been treated with 250 ppm of the compounds I-1, I-2, I-5, 1-6 or 1-7 showed at most 3% infection, whereas the untreated plants were 95% infected.

46

45

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



I

in which the substituents are as defined below:

R^1 is C_5-C_8-alkyl, C_4-C_{11}-alkoxymethylene or C_3-C_{10}-alkoxyethylene, where the aliphatic groups may be substituted by 1 to 3 of the following groups:

cyano, nitro, hydroxyl, C_3-C_6-cycloalkyl, C_1-C_6-alkylthio, C_5-C_{12}-alkynyl and NR^aR^b;

R^a, R^b are hydrogen or C_1-C_6-alkyl;

R^2 is n-propyl or n-butyl.

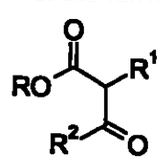
2. The compound of the formula I according to claim 1 in which R^1 is an unsubstituted straight-chain or mono-, di- or tribranched alkyl chain having up to 9 carbon atoms.

3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which R^2 is n-propyl.

4. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which R^2 is n-butyl.

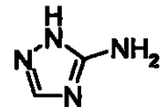
5. 6-(1-Methylheptyl)-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
6-octyl-5-propyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-butyl-6-(1-methylheptyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-butyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-propyl-6-(3,5,5-trimethylhexyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
6-hexyl-5-propyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
6-heptyl-5-propyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-propyl-6-undecyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine.

6. A process for preparing compounds of the formula I according to any of claims 1 to 5, wherein β-ketoesters of the formula II,



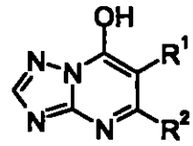
II

in which R is C_1-C_4-alkyl are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III



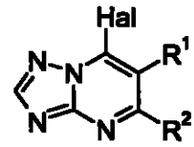
III

to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula IV



IV

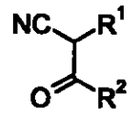
which are halogenated to give compounds of the formula V



V

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

7. A process for preparing compounds of the formula I according to any of claims 1 to 5, wherein acylcyanides of the formula VI,



VI

are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III as set forth in claim 6.

8. A fungicidal composition comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to any of claims 1 to 5.

9. Seed comprising a compound of the formula I according to any of claims 1 to 5 in amounts of 1 to 1000 g per 100 kg.

10. 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 according to any of claims 1 to 5.

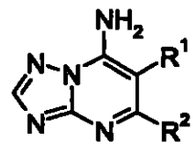
48

47

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines, method for their production, their use for controlling pathogenic fungi, and agents containing said compound

Abstract

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



I

in which the substituents are as defined below:

R^1 is alkyl, alkoxymethylene or alkoxyethylene, where the aliphatic groups may be substituted as defined in the description;

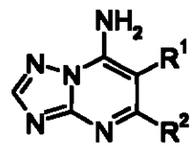
R^2 is n-propyl or n-butyl;

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

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

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



I

en la que los sutituyentes tienen los significados siguientes:

R^1 es alquilo C_5-C_9, alcoximetileno C_4-C_{11} o alcoxietileno C_3-C_{10}, pudiendo los grupos alifáticos estar sustituidos por uno a tres de los grupos siguientes:

ciano, nitro, hidroxi, cicloalquilo C_3-C_6, alquiltio C_1-C_6, alquinilo C_5-C_{12} o NR^aR^b;

R^a, R^b significan hidrógeno o alquilo C_1-C_6;

R^2 es n-propilo o n-butilo.

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.

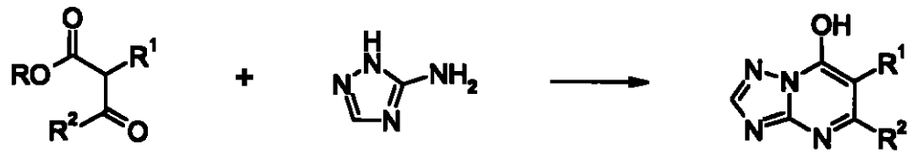
En la GB 1 148 629 se proponen en términos generales las 5,6-dialquil-7-amino-triazolopirimidinas. De la EP-A 141 317 se conocen algunas 5,6-dialquil-7-amino-triazolopirimidinas de acción fungicida. Sin embargo, su efecto es en muchos casos no satisfactorio, Partiendo de ello, la presente invención tiene por objeto proveer compuestos don efecto mejorado y/o espectro de acción más amplio.

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 5 del esqueleto de triazolopirimidina.

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 ß-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 R^1 y R^2 en las fórmulas II y IV tienen los significados indicados para la fórmula I y el grupo R en la fórmula II representa C_1-C_4-alquilo, por razones prácticas se prefiere metilo, etilo o propilo.

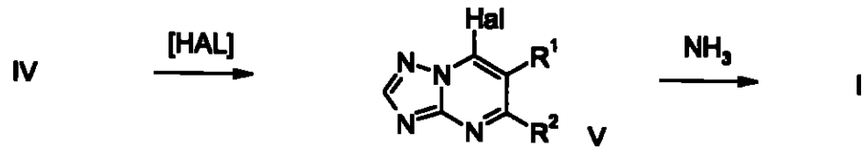


II III IV

La reacción de los ß-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 monoéteres glicólicos, dietilenglicoles o sus monoéteres, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, benceno o mesitileno, amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamidaa, 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, tri-isopropiletilamina, 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.

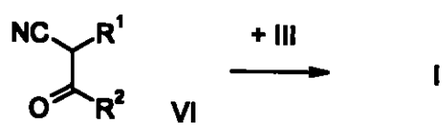


Los productos de condensación de la fórmula IV así obtenidos, generalmente, se precipitan a partir de las soluciones de reacción en forma pura y se transforman, después de haberlas lavado con los mismos disolventes o con agua y secado, con agentes de halogenación, especialmente agentes de cloración o 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 oxicloruro 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 aislan, opcionalmente tras evaporación del disolvente, por digestión en agua como compuestos cristalinos.

Los ß-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 reaccionar aciclianuros sustituidos de la fórmula VI, donde R^1 y R^2 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, 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, dietilformamidaa, 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.

Las nuevas 7-amino-triazolo[1,5-a]-pirimidinas se aislan, opcionalmente tras evaporación del disolvente o dilución con agua como compuestos cristalinos.

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 alquileno metálico (ver: J. Amer. Chem. Soc. Vol. 73, (1951) p. 3766).

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:

halógeno: fluoro, cloro, bromo e yodo;

alquilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales saturados con 1 a 4 o 5 a 9 átomos de carbono, p.ej. alquilo C_1-C_6, 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;

halógenometilo: grupo metilo donde los átomos de hidrógeno están parcial o completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los arriba mencionados, especialmente, clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo;

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

alcoxialquilo: cadena de hidrocarburo saturada, lineal o una, dos o tres veces ramificada, que está ligada por medio de un grupo metilenoxi o bien etilenoxi, por ejemplo, una cadena de hidrocarburo como la arriba descrita con 3 a 11 átomos de carbono, 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, hep-

tiloxi-propilo, octiloxi-propilo, noniloxi-propilo, 3-(3-etil-hexiloxi)-propilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-propilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-propilo;

Dentro del ámbito de la presente invención están comprendidos los isómeros (R) y (S) y los racemates 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:

Se prefieren los compuestos Ien los que el grupo R^1 tiene, como máximo 9 átomos de carbono.

Los grupos alquilo en R^1 en la fórmula I representan, preferentemente, un grupo alquilo no ramificado o una, dos, tres más veces ramificado, siendo preferido que el grupo alquilo no tenga ningún sustituyente.

Además, son preferidos los compuestos de la fórmula I, que en R^1 en el átomo de α-hidrógeno presentan una ramificación Se describen por medio de la fórmula Ia:

Ia

en la que R^{11} significa alquilo C_3-C_{10} o alcoxilaquilo C_5-C_{10} y R^{12} significa alquilo C_1-C_4-, especialmente, metilo, donde R^{11} y R^{12} presentan conjuntamente, como máximo, 12 átomos de carbono, y pueden ser no sustituidos o estar sustituidos como R^1 en la fórmula I.

Si R^1 representa un grupo alquilo sustituido por ciano, entonces el grupo ciano se encuentra, preferentemente, en el átomo de carbono terminal

En una variante de los compuestos según la invención I, R^1 representa alquilo C_5-C_9, alcoximetileno C_4-C_{11} o alcoxietileno C_3-C_{10}. Para estos grupos se prefieren cadenas de alcoxi de C_4-C_{10}.

Son especialmente preferidos los comnpuestos I, en los que R^1 significa n-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 o 1-etil-2-metilpropilo.

Además, son preferidos los compuestos de la fórmula I, en los que R^1 significa n-heptilo, 1-metilhexilo, n-octilo, 1-metilheptilo, n-nonilo, 1-metiloctilo y 3,5,5-trimetilhexilo.

En una variante de los compuestos I, R^2 significa n-propilo.

En otra variante de los compuestos I según la invención R^2 significa n-butilo.

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.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula I, en los que R^1 representa un compuesto de cada vez a una línea de la Tabla A y R^2 significa n-propilo

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I, en los que representa un compuesto de cada vez a una línea de la Tabla A y R^2 significa n-butilo

Tabla A

No.	R^1
A-1	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-2	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-3	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-4	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-5	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-6	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_3$
A-7	$CH(CH_3)CH(CH_3)_2$
A-8	$CH_2C(CH_3)_3$
A-9	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-10	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-11	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-12	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-13	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2CH_2$
A-14	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-15	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-16	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$

No.	R^1
A-17	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-18	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-19	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-20	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-21	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-22	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-23	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-24	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-25	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-26	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-27	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-28	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-29	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-30	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-31	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-32	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-33	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-34	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-35	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-36	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-37	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-38	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-39	$CH_2CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-40	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-41	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-42	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_3$
A-43	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-44	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-45	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-46	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$

No.	R^1
A-47	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-48	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-49	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-50	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-51	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-52	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-53	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-54	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-55	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-56	$CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_3$
A-57	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-58	$CH_2CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-59	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-60	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-61	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-62	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-63	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-64	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-65	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-66	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-67	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-68	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-69	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-70	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-71	$CH_2\text{-}O\text{-}C(CH_3)_3$
A-72	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2C(CH_3)_3$
A-73	$CH_2\text{-}O\text{-}CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-74	$CH_2\text{-}O\text{-}CH(CH_2CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-75	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-76	$CH_2\text{-}O\text{-}CH_2CH(CH_2CH_3)CH_2CH_2CH_3$

No.	R^1
A-77	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-78	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-79	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-80	CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-81	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_3$
A-82	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-83	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-84	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-85	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-86	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-87	CH_2CH_2-O-$CH(CH_3)_2$
A-88	CH_2CH_2-O-$C(CH_3)_3$
A-89	CH_2CH_2-O-$CH_2C(CH_3)_3$
A-90	CH_2CH_2-O-$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-91	CH_2CH_2-O-$CH(CH_2CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-92	CH_2CH_2-O-$CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-93	CH_2CH_2-O-$CH_2CH(CH_2CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-94	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-95	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
A-96	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-97	CH_2CH_2-O-$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$

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

Son especialmente importantes para combatir múltiples hongos en diferentes plantas de cultivo, tales como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, plátanos, 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,
- *Blumeria graminis* (oidio) 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,
- especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- especies de *Peronospora* en col y cebollas,
- *Phakopsora pachyrhizi* y *P. meibomiae* en soja,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- *Phytophthora capsici* en pepinos,
- *Plasmopara viticola* en vid,
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercosporella herpotrichoides* en trigo y cebada,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales,
- *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,
- 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 *oomicetos*, p.ej. especies de *Peronospora*, especies de *Phytophthora*, *Plasmopara viticola* y especies de *Pseudoperonospora*.

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

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

Generalmente, los productos fungicidas contienen de entre 0,1 y 95, preferentemente, 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 I pueden ser transformados en las formulaciones acostumbradas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. La forma de aplicación depende del fin respectivo, pero en todo caso debe estar asegurada una dispersión fina y uniforme del compuesto según la invención.

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), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grados

y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,

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

Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfíticas y metilcelulosa.

Sustancias apropiadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite directamente pulverizables son: fracciones de aceite mineral de punto de ebullición mediano hasta elevado, como p.ej. keroseno o aceite diesel, además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarbu-

ros alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

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

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

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

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

A) Concentrados solubles en agua (SL)

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

B) Concentrados dispersables (DC)

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

C) Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de los principios activos son disueltos en xileno adicionando dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5% respectivamente). Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión.

D) Emulsiones (EW, EO)

40 partes en peso de los principios activos son disueltos en xileno adicionando dodecilbencenosulfonato 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-

sión.

E) Suspensiones (SC, OD)

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

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

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, extrusionadora, torre de pulverización, lecho fluidizado). Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable del principio activo.

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

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

2. Productos para la aplicación directa

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.

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.

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

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

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

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

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

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

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

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

- acilalaninas, tales como benalaxilo, matalaxilo, ofurace, oxadixilo,
- derivados de amina, tales como aldimorf, dodine, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, esprixamina, tridemorf,
- anilinopirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirim o ciprodinilo,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomicina,
- azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, pro-

72
71

piconazol, procloraz, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol,

- dicarboximidas, tales como iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,
- ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamato, tiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, benomilo, boscalida, carbendazima, carboxima, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mepronilo, nuarimol, picobenzamida, probenazol, proquinazida, pirifenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina,
- fungicidas de cobre, tales como caldo de burdeos, acetato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacrilo, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles, tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,
- azufre
- otros fungicidas, tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, ácido fosforoso, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, tolclofos-metilo, quintozeno, zoxamida,

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

Ejemplos de síntesis

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.

Ejemplo 1: Preparación de 5-ciano-dodecan-4-ona

Una mezcla de 0,45 mol de decanitrilo en 300 ml tetrahidrofurano (THF) se mezcló a –70°C con una solución de 0,495 mol de butillio en hexano, entonces se agitó durante tres horas a esta temperatura y se adicionó 0,45 mol de butanoato de etilo. A continuación, se agitó todavía 16 horas 20 – 25°C, luego se agregaron 200 ml de agua y se acidificó con solución diluida de HCl. Después de la separación de las fases se separó la fase orgánica, se lavó con agua, se secó y se eliminó el disolvente. Quedaron 71 g del compuesto indicado en el título.

Ejemplo 2: Preparación de 7-amino-5-n-propil-6-octil-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina

Una mezcla de sendos 1,27 mol de 5-ciano-dodecan-4-ona del Ejemplo 1 y de 3-amino-1,2,4-triazol y 0,25 mol de ácido p-toluenosulfónico en 900 ml de mesitileno se calentó aprox. 4 horas a 170°C. Después de enfriar a 20 - 25°C se filtró el precipitado, que luego se absorbió en diclorometano. A partir de la solución se destiló el disolvente tras lavado con agua y secado; como residuo quedaron 102 g del compuesto indicado en el título de p.f. 165°C.

Tabla I – Compuestos de la fórmula I

No.	R^1	R^2	Datos físicos (p.f. [°C])
I-1	$CH(CH_3)(CH_2)_5CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	145
I-2	$(CH_2)_7CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	165
I-3	$CH(CH_3)(CH_2)_5CH_3$	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	116
I-4	$(CH_2)_7CH_3$	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	145
I-5	$(CH_2)_2CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	$CH_2CH_2CH_3$	185
I-6	$(CH_2)_5CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	174-175
I-7	$(CH_2)_6CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	169-170
I-8	$(CH_2)_{10}CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$	138-139
I-9	$(CH_2)_5CN$	$CH_2CH_2CH_3$	158

Ejemplos del efecto contra hongos nocivos

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

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

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

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 de determinó visualmente el desarrollo de la infección en los lados inversos de las hojas.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-6 o bien I-7 presentaron una infección de, como máxmimo un 10%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90%.

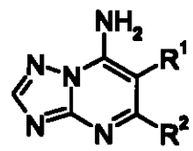
Ejemplo de aplicación 2: Actividad contra el mildiú en tomates causado *Phytophthora Infestans* en el tratamiento protector

Las hojas de plantas de tomates en macetas se pulverizaron hasta chorrear con una 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 tratadas, que la infestación pudo ser determina visualmente en por cien.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos I-1, I-2 , I-5, I-6 o bien I-7 estaban infectadas en, como máximo un 3%, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta 95%.

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



I

en la que los sutituyentes tienen los significados siguientes:

R^1 es alquilo C_5-C_9, alcoximetileno C_4-C_{11} o alcoxietileno C_5-C_{10}, pudiendo los grupos alifáticos estar sustituidos por uno a tres de los grupos siguientes:

ciano, nitro, hidroxi, cicloalquilo C_3-C_8, alquiltio C_1-C_8, alquinilo C_5-C_{12} o NR^aR^b;

R^a, R^b significan hidrógeno o alquilo C_1-C_6;

R^2 es n-propilo o n-butilo.

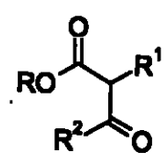
2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde R^1 significa una cadena de alquilo una, dos o tres veces ramificada con hasta 9 átomos de carbono.

3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R^2 significa n-propilo.

4. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R^2 significa n-butilo.

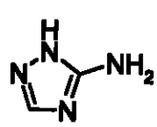
5. 6-(1-Metil-heptil)-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
6-octil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
5-butil-6-(1-metil-heptil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
5-butil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina ;
5-propil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina
6-hexil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
6-heptil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
5-propil-6-undecil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina..

6. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque se transforman ß-ceto ésteres de la fórmula II,



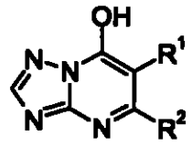
II

en la que R significa alquilo C_1-C_4, con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III



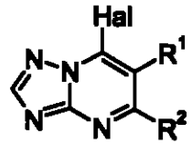
III

en 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV



IV

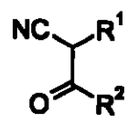
que se halogenan en compuestos de la fórmula V,



V

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

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



VI

con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III según la reivindicación 6.

8. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5.

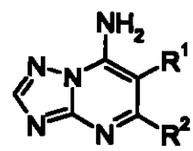
9. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5 en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.

10. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5.

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

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



I

en la que los sutituyentes tienen los significados siguientes:

R^1 es alquilo C_5-C_8, alcoximetileno C_4-C_{11} o alcoxietileno C_3-C_{10}, pudiendo los grupos alifáticos estar sustituidos por uno a tres de los grupos siguientes:

ciano, nitro, hidroxi, cicloalquilo C_3-C_8, alquiltio C_1-C_8, alquinilo C_5-C_{12} o NR^aR^b;

R^a, R^b significan hidrógeno o alquilo C_1-C_8;

R^2 es n-propilo o n-butilo;

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

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055414/NI	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/IPEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002426	Internationales Anmeldedatum *(Tag/Monat/Jahr)* 08.03.2005	Prioritätsdatum *(Tag/Monat/Jahr)* 10.03.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04 A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen
   a. ☒ *(an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt)* insgesamt 2 Blätter; dabei handelt es sich um
      ☒ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).
      ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.
   b. ☐ *(nur an das Internationale Büro gesandt)* insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben) , der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).

4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

☒	Feld Nr. I	Grundlage des Berichts
☐	Feld Nr. II	Priorität
☐	Feld Nr. III	Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
☐	Feld Nr. IV	Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
☒	Feld Nr. V	Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
☐	Feld Nr. VI	Bestimmte angeführte Unterlagen
☐	Feld Nr. VII	Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
☐	Feld Nr. VIII	Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 29.06.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 02.06.2006
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde Europäisches Patentamt - Gitschiner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Hass, C Tel. +49 30 25901-340

82

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen 81
PCT/EP2005/002426

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bescheid auf

   ☒ der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde.

   ☐ einer Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache , bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
   - ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 a) und 23.1 b))
   - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4 a))
   - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 a) und/oder 55.3 a))

2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt)*:

   Beschreibung, Seiten

   1-18 — in der ursprünglich eingereichten Fassung

   Ansprüche, Nr.

   1-10 — eingegangen am 16.05.2006 mit Telefax

   ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
   - ☐ Beschreibung: Seite
   - ☐ Ansprüche: Nr.
   - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
   - ☐ Sequenzprotokoll *(genaue Angaben)*:
   - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen *(genaue Angaben)*:

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigefügten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
   - ☐ Beschreibung: Seite
   - ☐ Ansprüche: Nr.
   - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
   - ☐ Sequenzprotokoll *(genaue Angaben)*:
   - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen *(genaue Angaben)*:

* *Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.*

82 83

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/002426

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

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja:	Ansprüche	1-10
	Nein:	Ansprüche	
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja:	Ansprüche	1-10
	Nein:	Ansprüche	
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja:	Ansprüche:	1-10
	Nein:	Ansprüche:	

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

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

V.1 Zitierte Dokumente

D1: EP-A-0 141 317 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15. Mai 1985 (1985-05-15)
D2: WO 03/009687 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 6. Februar 2003 (2003-02-06)
D3: EP-A-0 215 382 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 25. März 1987 (1987-03-25)
D4: GB-A-1 148 629 (VEB. DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN) 16. April 1969 (1969-04-16)
D5: EP-A-0 770 615 (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2. Mai 1997 (1997-05-02)

Die angegebenen Bezeichnungen gelten für das gesamte Prüfungsverfahren.

V.2 Neuheit

V.2.1 Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist vom Gegenstand der Ansprüche 1-6 des Dokuments D1 generisch umfasst. Es gibt aber in D1 keine konkreten Einzelverbindungen, die unter die vorliegenden Ansprüche fallen: Bei denjenigen konkreten D1-Verbindungen, bei denen R^2 n-Propyl oder n-Butyl ist, fällt der Rest R^1 gerade außerhalb des in der Anmeldung beanspruchten Bereiches, und bei denjenigen konkreten D1-Verbindungen, bei denen R^1 in den hier beanspruchten Bereich fällt, ist R^2 nicht n-Propyl oder n-Butyl (siehe D1, Tabelle auf den Seiten 9 und 10). Daher beruht der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche auf einer neuen Auswahl aus D1.

V.2.2 Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche unterscheidet sich von der Offenbarung in D2 durch die Definition der Gruppe R^2, die der Gruppe X in D2 entspricht.

V.2.3 Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche unterscheidet sich von den in D3 offenbarten Verbindungen zumindest darin, dass dort der der Gruppe R^1 entsprechende Rest immer eine Arylgruppe trägt.

V.2.4 In den in D4 offenbarten Verbindungen hat die R^1 entsprechende Alkylgruppe nur maximal 4 C-Atome.

V.2.5 D5 offenbart ein Verfahren zur Herstellung der Zwischenprodukte der Formeln IV und V. Bei den konkret in D5 genannten Verbindungen ist jedoch der der Gruppe R^1 entsprechende Rest Phenyl.

V.2.6 Somit ist der Gegenstand aller vorliegenden Ansprüche neu.

V.3 Erfinderische Tätigkeit

V.3.1 Gemäß der Beschreibung ist die der Anmeldung zugrunde liegende Aufgabe darin zu sehen, 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine bereitzustellen, die den aus D1 bekannten ähnlichen Verbindungen in ihrer fungiziden Wirkung überlegen sind.

V.3.2 Relevanter Stand der Technik für den Gegenstand des Anspruchs 1 sind die Dokumente D1 bis D3, da sie fungizid wirksame 7-Amino-triazolopyrimidine offenbaren. Der strukturell nächste Stand der Technik ist D1, da es Verbindungen offenbart, von denen sich die anmeldungsgemäßen Verbindungen entweder nur hinsichtlich der Gruppe R^1 unterscheiden (Verbindungen 16, 21, 23, 42 und 48 aus D1) oder von denen sie sich nur hinsichtlich der Gruppe R^2 unterscheiden (z. B. Verbindungen 4, 10, 11, 12, 29 aus D1). Generisch sind die anmeldungsgemäßen Verbindungen vollständig von der Offenbarung von D1 umfasst (siehe D1, Ansprüche).

V.3.3 Der Fachmann, der vor der oben definierten Aufgabe steht, würde sicherlich die allgemeine Offenbarung aus D1 zum Anlass nehmen, neue, aber innerhalb der generischen Offenbarung von D1 liegende Verbindungen herzustellen, wobei er davon ausgehen könnte, dass diese Verbindungen ebenfalls fungizide Eigenschaften hätten. Genau das ist im vorliegenden Fall getan worden: Die Anmelderin hat Gruppen R^1 konkret in D1 genannter Verbindungen und Gruppen R^2 anderer konkret in D1 genannter Verbindungen kombiniert und ist damit direkt zu den anmeldungsgemäßen Verbindungen gelangt. Somit ist es grundsätzlich nicht überraschend, dass die anmeldungsgemäßen Verbindungen ebenfalls, wie die D1-Verbindungen, fungizid wirken.

V.3.4 Die Anmelderin hat nun Vergleichsversuche zwischen bestimmten anmeldungsgemäßen Verbindungen und konkret in D1 genannten Verbindungen vorgelegt, aus denen hervorgeht, dass dann, wenn R^2 n-Propyl oder n-Butyl ist und gleichzeitig R^1 der speziellen in Anspruch 1 gegebenen Definition entspricht (eine Kombination, wie sie in D1 nicht verifiziert wurde), gegenüber konkret in D1 genannten, strukturähnlichen Verbindungen eine wesentliche Verbesserung der Wirkung gegenüber bestimmten Schadpilzen auftritt. Zum Vergleich wurden Verbindungen aus D1 verwendet, deren R^2 entsprechender Substituent ebenfalls n-Propyl bzw. n-Butyl ist, so dass der strukturelle Unterschied lediglich durch R^1 bestimmt wird. Hierbei ergab sich eine nicht vorhersehbare signifikante Verbesserung der Wirkung bei den getesteten anmeldungsgemäßen Verbindungen mit den Resten R^1 = C_5-Alkyl oder C_9-Alkyl oder C_6-Alkoxyethylen oder C_8-Alkoxyethylen.

V.3.5 Die Vergleichsversuche zeigen, dass mit dem Gegenstand der Ansprüche die oben definierte technische Aufgabe tatsächlich gelöst wurde. Die Wirkungsverbesserung aufgrund des spezifischen Substituenten R^1, die mit den Vergleichsversuchen glaubhaft gemacht wurde, wird im relevanten Stand der Technik nicht nahegelegt und ist daher überraschend.

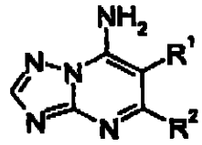
V.3.6 Erfinderische Tätigkeit kann daher für den Gegenstand der nun vorliegenden Ansprüche 1 bis 10 anerkannt werden.

V.4 Gewerbliche Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist gewerblich anwendbar.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



I

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R^1 C_5-C_9-Alkyl oder C_3-C_{10}-Alkoxyethylen;

R^2 n-Propyl oder n-Butyl.

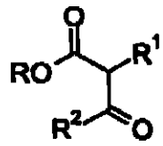
2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R^1 für eine unsubstituierte unverzweigte oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte Alkylkette mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen steht.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin R^2 für n-Propyl steht.

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin R^2 für n-Butyl steht.

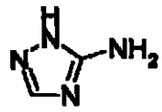
5. 6-(1-Methyl-heptyl)-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
6-Octyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
5-Butyl-6-(1-methyl-heptyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
5-Butyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
5-Propyl-6-(3,5,5-trimethyl-hexyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
6-Hexyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
6-Heptyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin.

6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man ß-Ketoester der Formel II,



II

in der R für C_1-C_4-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III

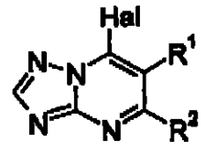


III

zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV

IV

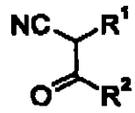
umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,



V

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

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,



VI

mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III gemäß Anspruch 6 umsetzt.

8. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5.

9. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 in Mengen von 1 bis 1000 g pro 100 kg.

10. 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 5 behandelt.

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

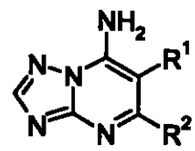
PARA EFECTUAR

EXAMEN DE PATENTABILIDAD

90
89

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



I

en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R^1 es alquilo C_5-C_9 o alcoxietileno C_3-C_{10}

R^2 es n-propilo o n-butilo.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde R^1 significa una cadena de alquilo una, dos o tres veces ramificada con hasta 9 átomos de carbono.

3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R^2 significa n-propilo.

4. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R^2 significa n-butilo.

5. 6-(1-Metil-heptil)-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
6-octil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;
5-butil-6-(1-metil-heptil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

~~41~~ 90

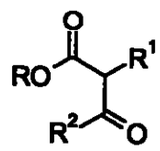
5-butil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina ;

5-propil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina

6-hexil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina;

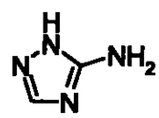
6-heptil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina.

6. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque se transforman ß-ceto ésteres de la fórmula II,



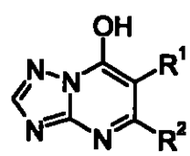
II

en la que R significa alquilo C_1-C_4, con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III



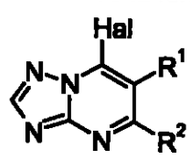
III

en 7-hidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV



IV

que se halogenan en compuestos de la fórmula V,



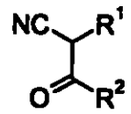
V

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

92

91

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



VI

con 3-amino-1,2,4-triazol de la fórmula III según la reivindicación 6.

8. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5.

9. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5 en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.

10. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5.

Industria y Comercio

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS

Royal Technologies S.A.

Item	Expediente No	06090485	No de Folio
		No de unidades	√
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	1	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones: Sobre Con Arte Final

92

~~95~~
93

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-090485- -00000-0000
Fec: 2006-09-08 17:13:04 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios: 95

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 63,963
FECHA : AGOSTO 22 DE 2006

C O N S I G N A C I O N

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050 00110-6	49368279	22/08/2006	42,102,000.00

C O N C E P T O

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
		TOTAL : $	463,000.00

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

Cdo 00361-841-127-0

96

94

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-090485- -00000-0000
Fec: 2006-09-08 17:13:04 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios: 95

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION [✓] MODELO DE UTILIDAD [ ]

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

COMPLETA [ ] INCOMPLETA [ ]

DISEÑO INDUSTRIAL [ ]

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

COMPLETA [ ] INCOMPLETA [ ]

ESQUEMA DE TRAZADO [ ]

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

COMPLETA [ ] INCOMPLETA [ ]

Firma Responsable

Fecha Sept. 08/06.

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

95

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio ~~97~~

2020
Bogotá D.C.,

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

REFERENCIA	Radicación No.	06 90485
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/002426
	Fecha inicio fase nacional	10/10/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	1893
	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, 07 NOV. 2008

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

adpa11