



Industria y Comercio

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

Q.P.

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-128580

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIMIDINA Y SU USO

PARA CONTROLAR HONGOS NOCIVOS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

A01N43/90

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438,019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,

22/12/2006.

SS



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 06-128580- 00000-0000

Fec: 2008-12-22 11:33:34 Dep. 2020 NUECREACIONES

Tra. 11 PATENTE/MI

Evo: 378 FASE NACIONAL

Act 411 PRESENTACION

Folios. 202

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 AKTIENGESSELLSCHAFT
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de: Republica Federal de Alemania

Dirección: 67056 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

Domicilio: Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

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

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual

Número 438.019 T.P 31.929

4

INVENTOR (ES)
(72)

1. Cartsten BLETNER
Unit. A 4/F, No. 23 Repulse Bay Road
Hong Kong,
China
2. Frank SCHIEWECK
Lindenweg 4,
67258 HeBheim,
República Federal de Alemania
3. Jordi TORMO I BLASCO
Carl-Benz-Str. 10-3,
68514 Lauderbach,
República Federal de Alemania
4. Bern MÜLLER
Stockinger Str. 7,
67227 Frankenthal,
República Federal de Alemania
5. Markus GEWEHR
Goethestr. 21,
56288 Kastellaun,
República Federal de Alemania
6. Wassilios GRAMMENOS
Alexander-Fleming-Str. 13,
67071 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania
7. Thomas GROTE
Im Höhnhausen 18,
67157 Wachenheim,
República Federal de Alemania

10. Anja SCHWÖGLER
Heinrich-Lanz-Str. 3,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania
11. Oliver WAGNER
Im Meisental 50,
67433 Neustadt,
República Federal de Alemania
12. John – Bryan SPEAKMAN
In den Hahndomen 7,
67273 Bobenheim
República Federal de Alemania
13. Thorsten JABS
Richard-Wagner-Str. 52g,
67454 HaBloch
República Federal de Alemania
14. Siegfried STRATHMANN
Donnersbergstrasse. 9,
67117 Limburgerhof
República Federal de Alemania
15. Ulrich SCHÖFL
Erlenstr. 8,
68782 Brühl,
República Federal de Alemania
16. Maria SCHERER
Hermann-Jürgens-Strasse.30,
76829 Godramstein
República Federal de Alemania

8. Joachim RHEINHEIMER
Merziger Strasse 24,
67063 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

17. Reinhard STIERL
Jahnstr. 8,
67251 Freinsheim,
República Federal de Alemania

9. Peter SCHÄFER
Römerstr. 1,
67308 Ottersheim,
República Federal de Alemania

5

PCT (86)Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/006855Fecha: 24 de Junio de 2005Publicación Internacional No. WO 2006/000436 A1Fecha: 05 de Enero 2006

6

TÍTULO (54)**COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIMIDINA Y SU USO PARA CONTROLAR
HONGOS NOCIVOS**

7

Clasificación Internacional (51) C07D 487/04401N43/90.

8

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐DE25 de Junio de 200410 2004 030 816.0

9

Comprobante de pago No.: 06-89,329**Fecha: Noviembre 21 de 2006**

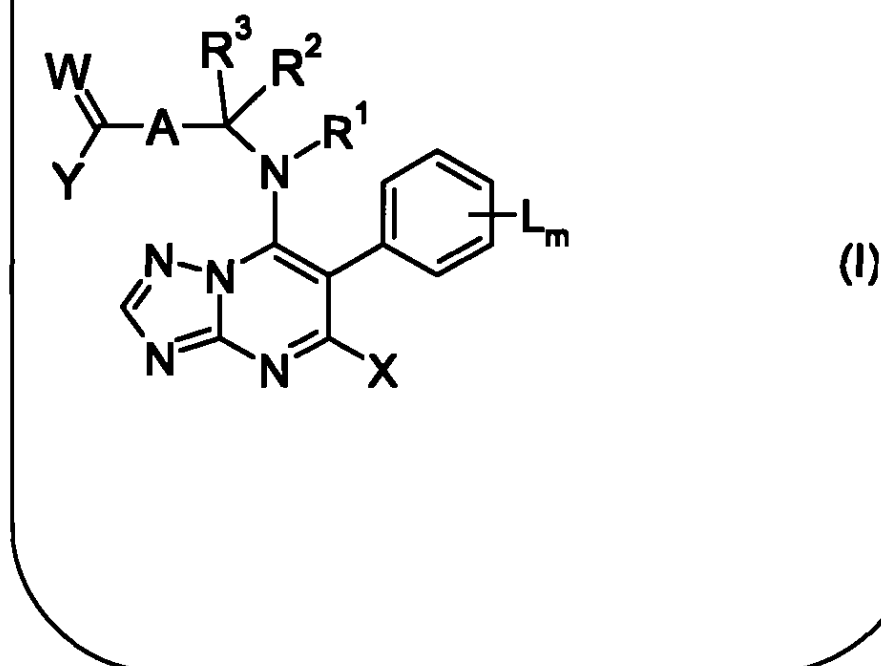
10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :


C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2006/000436 A1

Descripción:

Páginas en el idioma original 73

Páginas en español 80

Reivindicaciones: Número (s) 13

Figuras: Número (s)

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

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

REPRESENTACION Y PODER

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

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

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

Dado y firmado hoy ..17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

Firma
ppa. Welzel

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

wohnhaft in Ludwigshafen, República Federal de Alemania

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

Ausserdem, und unter denselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentums erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), die in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendeten, einer oder anderen, ordnungsgemäss werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Unterzeichnet heute am ..17. März 1989

in D-6700 Ludwigshafen

Unterschrift
ppa. Richters



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

N-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 Re-
gional de Frankenthal (Pfalz)-----
que la compañía BASF Aktiengesellschaft-----
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
de la República Federal de Alemania y cumple su objeto
conforme a las mismas; que el(los) señor(es) Dr. Gunther
WELZEL y el Dr. Peter RICHTERS-----
quien(es) en sus carácter(es) de apoderados-----
----- y cuya(s)-----
(fueron) autenticada(s) ante el Notario-----
----- es(son) su(s) representa-
te(s) legal(es) en este país.

NOTARIO SEÑOR DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
DE LA FIRMA DEL SEÑOR
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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

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

Frankfurt a. M 06 APR 1989

N-0077

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por Ley 84 de 1959 Art. 100



Martha Niño de Staud
Cónsul General de Colombia

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

04 DIC 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES

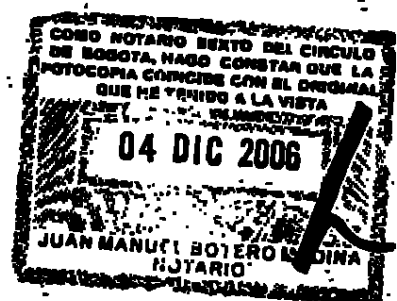
Bogotá No. 85064
12 ABR 1988

Martha Nino

Yo firmo en nombre del Estado de Colombia
el presente documento, dándole fe de su autenticidad
y legalidad en el presente.

Manuel Botero Medina

MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO



Die konsularische Legalisierung ist notwendig.

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



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

04 DIC 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

8

LA LEY PRETENDIENDO QUE
TENDRAN QUE VERSE LOS

SE EN ESTAN ALIENAN...
CON ALGUN VALOR

EN CERO (0)

881051589554

B. C. C: 16
SUCURSAL CORPORATIVA



MINISTERIO DE HACIENDA
Y CREDITO PUBLICO
NACION

16 013 01 000045 1
REGISTRO DE IMPUESTOS
16 013 01 000045 1

① Administración de impuestos de: BOGOTA		Código: 0,3	⑤ Teléfono: 2120100
② Documento de identificación (marque X) C.C. o T.I. ☐ NIT. ☒ No. 860041367 D.V. ☒		④ Apellidos y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres): CAVELIER ABOGADOS	
③ C.C. o T.I. ☐ NIT. ☒ No. 19'301.629 D.V. ☐		④ Apellidos y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres): BOJERO ROCHA JAIME	
⑥ Dirección (de la persona o entidad identificada en la celda 4) Cra. 4a. No. 72-35		Municipio: BOGOTA	Departamento: CUNDINAMARCA
⑦ Número documento tributario: 1			

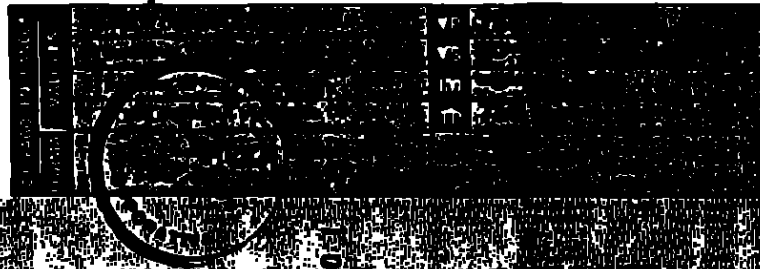
TRANSACCION OPTIMA No. 2046 DE ABRIL 26 DE 1997
TRANSACCION OPTIMA DE LA FISCALIA
CRA. 4a. No. 72-35

6048171
STYLED SOFONIN 30 NODOS
STYLED SOFONIN 35 NODOS
STYLED SOFONIN 40 NODOS

Responsable del pago

Nombre: /

C.C. No. 19301629



DESA-31-V-88

CONTRIBUYENTE

COPIA
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

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

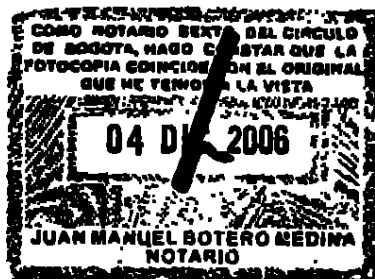
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

Protocolo notarial No. 1407/89

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

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

A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona.



LUZ ARRIAGA DE HERBES
TRADUCCION E INTERPRETE OFICIAL
Registrada No. 599 Ministerio

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

Notario de Ludwigshafen

Th. Walter

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

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

Frankenthal (Pfalz), veintiuno de marzo de mil noventa y nueve



LUZ ARRIAGA DE MEJIA
TRADUCTORA INTERPRETE
Resolución No. 599 Michellina

El Presidente del Tribunal Regional

Firma: firma ilegible (sello redondo)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

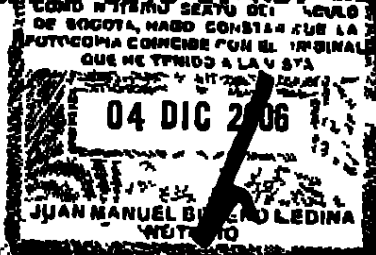
Notas: Derechos 20,-- DM

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

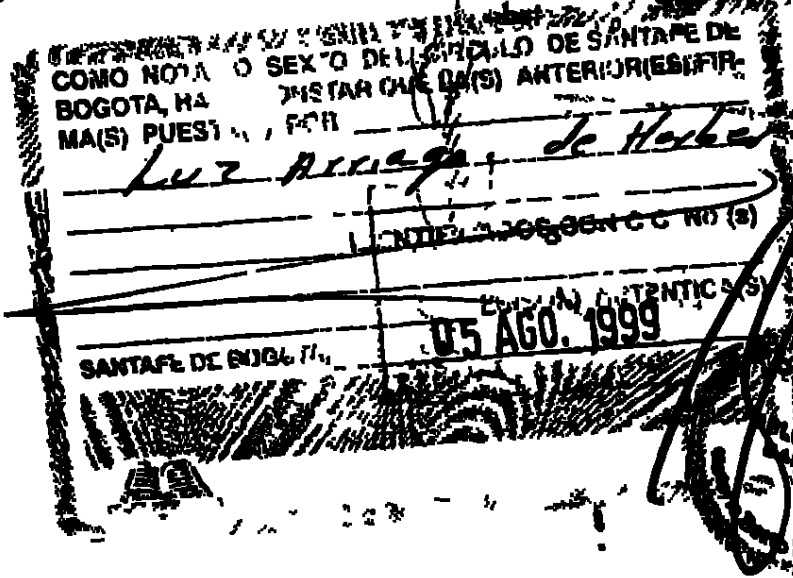
Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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

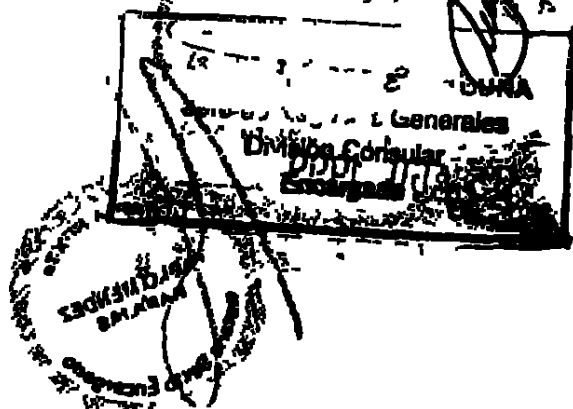
Bogotá, 26 de abril de 1989



LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL



ਅੰਤਰਿਕ ਸੰਗੀਤ



DMC Corporate

1997

12

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª, No 72-35
BOGOTÁ 8 COLOMBIA

COBRE ELECTRONICO MUNDIAL CAVE

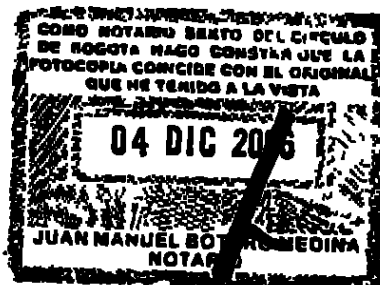
TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLE CAVELEYES

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

Poderdante BASF AKTIENGESELLSCHAFT

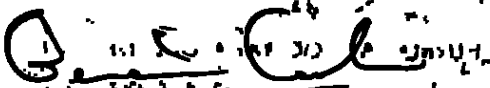
Poder conferido el. 17-03-89



Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, solemnemente manifiesto a Usted que sustituyo el poder conferido en el doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No 31 929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

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

Señor Jefe,


GERMAN CAVELIER

T P A No. 832

C C No 2 877 924 de Bogotá

Acepto



EMILIO FERRERO

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, compareció, el Doctor EMILIO FERRER

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 429271
expedida en VAQUERÍA y la tarjeta profesional
número 21.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: R.D. HUARTE (Alcalde)
y declaró que la firma que aparece en él es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art. 1ro. del Decreto 2282 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá, compareció, el Doctor Emilio Ferrer

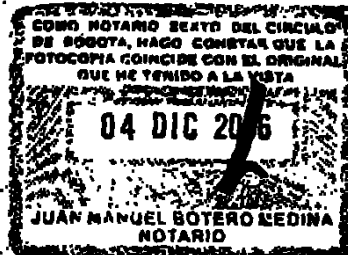
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 207274
expedida en VAQUERÍA y la tarjeta profesional
número 677 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: Director Nuevo Crear
y declaró que la firma que aparece en él es: uya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

domiciliado(s) en

- +Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
- +Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Germany
Citizen of Germany
- ~ +Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudendach
Germany
Citizen of Spain
- +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 Hühnhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
- ~ +Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
- ~ +Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany
- ~ +Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

1. **Oliver Wagner**
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
2. **John-Bryan Speakman**
In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim
Germany
Citizen of United Kingdom
3. **Thorsten Jabs**
Richard-Wagner-Str.52g, 67454 Haßloch
Germany
Citizen of Germany
4. **Siegfried Strathmann**
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Germany
Citizen of Germany
5. **Ulrich Schöfl**
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
6. **Maria Scherer**
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein
Germany
Citizen of Germany
7. **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:

COMPUESTOS DE TRIAZOLOPYRIMIDINA
Y SU USO PARA CONTROLAR
HONGOS NOCIVOS.

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

Alemania

domiciliada en

67056 Ludwigshafen, Alemania

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

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

Triazolopyrimidine compounds and their use for controlling
harmful fungi

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

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Germany

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

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

CAVELIER ABOGADOS

WPFODERE-343

CO Andipatent Form 01 11/98

15

Dado y firmado hoy Given and signed this 04. Juli 2005
Firma Signature


Carsten Blettner


Frank Schieweck

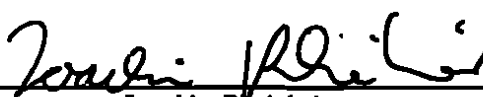

Jordi Torro i Blasco

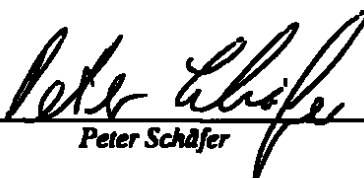

Bernd Müller

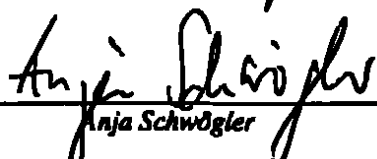

Markus Gewehr

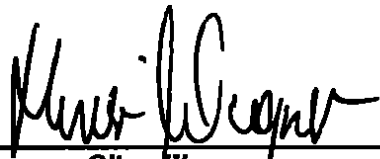

Wassilios Grammenos


Thomas Grote


Joachim Rheinheimer


Peter Schäfer


Anja Schwögl



Oliver Wagner



John-Bryan Speakman



Thorsten Jabs



Siegfried Strüthmann



Ulrich Schöff



Maria Scherer



Reinhard Stierl

Notarization and legalized by means of Apostille

CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignments Form 01 11/08

U.R.Nr. 1634/2005

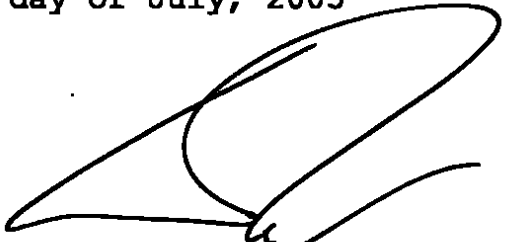
I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

- a) Mr. Carsten **Blettner**, residing at Richard-Wagner Str. 48, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
- b) Mr. Frank **Schieweck**, residing at Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Germany, personally known to me,
- c) Mr. Jordi **Tormo i Blasco**, residing at Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Germany, Citizen of Spain, personally known to me,
- d) Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
- e) Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
- f) Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, Citizen of Greece, personally known to me,
- g) Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to me,
- h) Mr. Joachim **Rheinheimer**, residing at Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
- i) Mr. Peter **Schäfer**, residing at Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Germany, personally known to me,
- j) Mrs. Anja **Schwögl**, residing at Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
- k) Mr. Oliver **Wagner**, residing at Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Germany, personally known to me,
- l) Mr. John-Bryan **Speakman**, residing at In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Germany, Citizen of United Kingdom, personally known to me,

- 18
- m) Mr. Thorsten **Jabs**, residing at Richard-Wagner-Str. 52g, 67454 Haßloch, Germany, personally known to me,
 - n) Mr. Siegfried **Strathmann**, residing at Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Germany, personally known to me,
 - o) Mr. Ulrich **Schöfl**, residing at Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Germany, personally known to me,
 - p) Mrs. Maria **Scherer**, residing at Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Godramstein, Germany, personally known to me,
 - q) Mr. Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Germany, personally known to me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 4th day of July, 2005



notary public



Wert 5.112,92 €

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 19. Juli 2005
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 830-847/05

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



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

Kostenvermerk:
Gebühr 12,- €

129

TRADUCCIÓN OFICIAL 310/2006 DE UN DOCUMENTO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL AUTORIZADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE COLOMBIA. DE ACUERDO CON DICHO DOCUMENTO, LOS ABAJO FIRMANTES, A SABER:

Carsten Blettner, Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Alemania, ciudadano de Alemania;

Frank Schieweck, Lindenweg 4, 67258 Hessheim, Alemania, ciudadano de Alemania;

Jordi Tormo i Blasco, Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Alemania, ciudadano de España;

Bernd Müller, Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, Alemania, Ciudadano de Alemania;

Markus Gewehr

Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Alemania, ciudadano de Alemania
Wassilios Grammenos

Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, Ciudadano de Grecia;

Thomas Grote

Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, ciudadano de Alemania

Joachim Rheinheimer

Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano de Alemania

Peter Schäfer

Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Alemania, ciudadano de Alemania

Anja Schwögler

Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania, ciudadano de Alemania

Oliver Wagner

21
Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania, ciudadano de Alemania

John-Bryan Speakman

In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Alemania, ciudadano del
Reino Unido

Thorsten Jabs

Richard-Wagner-Str. 52g. 67454 Hassloch, Alemania, ciudadano de
Alemania

Sigfried Strathmann

Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof, Alemania, ciudadano de
Alemania

Ulrich Schöfl

Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania, ciudadano de Alemania

María Scherer

Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein, Alemania, ciudadano de
Alemania

Reinhard Stierl

Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania, ciudadano de Alemania

DECLARAN BAJO JURAMENTO SER LOS INVENTORES ÚNICOS Y VERDADEROS DE
LA INVENCION **COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIMIDINA Y SU USO PARA
CONTROLAR HONGOS NOCIVOS.** ADEMÁS QUE CEDEN SIN RESERVAS NI
LIMITACIONES EN FAVOR DE **RASF AKTIENGESSELLSCHAFT**, UNA SOCIEDAD
CONSTITUIDA Y EXISTENTE DE CONFORMIDAD CON LAS LEYES DE ALEMANIA,
DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, TODOS LOS DERECHOS
INHERENTES A DICHA INVENCION Y QUE LA CITADA COMPAÑIA QUEDA
FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE
EN LA REPUBLICA DE COLOMBIA. DADO Y FIRMADO POR TODOS LOS
INVENTORES ARRIBA MENCIONADOS

U.R. NR. 1634/2005

Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen/Rhine,
República Federal de Alemania, por la presente certifico y
confirmando que las anteriores firmas (a continuación siguen los

✓✓

Eduardo Calato 3.

Edmundo Colado Magaña
TRADUCTOR OFICIAL
INGLÉS - ESPAÑOL - INGLÉS
Avda. 541, Febrero de 1976

Dec. 541. Febrero do 1976

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

537082
Edardo Calado
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

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

CONCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA SANTAFE DE BOGOTA. 05 DIC 2006

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DE LA FIRMA
2006 DIC - 5 FOLIO 4
JOS
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

REPUBLICA DE COLOMBIA
BOGOTA D.C.

TRADUCCION OFICIAL No. 11689

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

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

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

24

f

Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Alemania
Ciudadano de Alemania
John-Bryan Speakman
In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim
Alemania
Citizen del Reino Unido
Thorsten Jabs
Richard-Wagner-Str.52g, 67454 Haßloch
Alemania
Ciudadano de Alemania
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Alemania
Ciudadano de Alemania
Ulrich Schöff
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Alemania
Ciudadano de Alemania
Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str.30, 78829 Godramstein
Alemania
Ciudadano de Alemania
Reinhard Stierl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

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

COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIMIDINA Y SU USO PARA CONTROLAR HONGOS NOCIVOS

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Hay diecisiete firmas ilegibles de los mencionados señores. - Dado y firmado el 04 de julio de 2005 en 67056 Ludwigshafen, Alemania.-

LUZ APATACA DE HENRER
TRADUCTORA Y INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.598 Minjusticia

28
25

Sigue certificación notarial en Inglés (individuo) de las diecisiete firmas
antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el
04 de julio 2005. Fdo.: firma ilegible, (hilo y oblea notarial en relieve)

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 19 de julio de 2005
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb – 830-847/05
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, 02 de diciembre de 2006

C. 2799

LIZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCCION e INTERPRETE OFICIAL
Liz Arriaga de Herber
Matrícula No. 609 Bogotá

**MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES**

5-210

537082

WOL
JEFE DE LEGALIZACIONES
BUGOTIA D.C.

780165
Cuya firma aparece en el
documento de empeña
las funciones indicadas

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

Prof. George A. G. G.

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

05-01-2005

REPUBLICA DE COLOMBIA
BOGOTA D.C.

5 P 12:48
WOS
LEGALIZACIONES
GOTA D.C.

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
5. Januar 2006 (05.01.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/000436 A1

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/006855

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. Juni 2005 (24.06.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 030 816.0 25. Juni 2004 (25.06.2004) 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): BLETTNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudendach (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 Hühnhäusen 18, 67157 Wachenheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Röhrerstr. 1, 67308 Ottersheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Heinrich-Janz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE]; Im Melsental 50, 67433 Neustadt (DE). SPEAKMAN, John-Bryan [GB/DE]; In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim (DE). JANS, Thorsten [DE/DE]; Richard-Wagner-Str. 52g, 67454 Hasloch (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl (DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Godesheim (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim (DE).

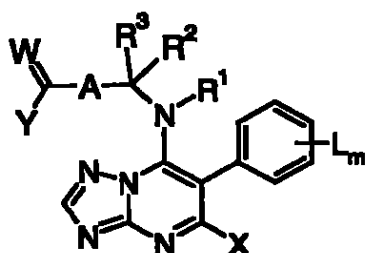
(74) Anwalt: REITSTÜTTER, KINZEBACH & PARTNER (GBR); Ludwigsplatz 4, 67059 Ludwigshafen (DE).

(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, CY, 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, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINE COMPOUNDS AND THEIR USE FOR CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDIN-VERBINDUNGEN UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel triazolopyrimidine compounds of general formula (I) wherein: X represents halogen, cyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₂ alkoxy halide; W represents oxygen or sulfur; Y represents O-R⁸ or a group NR⁸R⁹; A represents a chemical bond or a group CR⁸R⁹, and; variables L, R¹ to R⁹ have the definitions cited in Claim 1. The invention also relates to the use of the triazolopyrimidine compounds of general formula (I), their tautomers and their agriculturally compatible salts for controlling plant-pathogenic fungi, and to a method for controlling plant-pathogenic fungi, which is characterized in that the fungi or the materials, plants, soil or seeds to be

protected from fungal attack are treated with an effective amount of a compound of general formula (I), a tautomer (I) and/or with an agriculturally compatible salt of (I) or of the tautomer thereof.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin: X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht; W Sauerstoff oder Schwefel bedeutet; Y für O-R⁸ oder eine Gruppe NR⁸R⁹ steht; A für eine chemische Bindung oder eine Gruppe CR⁸R⁹ steht; und die Variablen L, R¹ bis R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben. Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung der Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I), ihrer Tautomere und deren landwirtschaftlich verträglichen Salze zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (= Schadpilzen) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, das dadurch gekennzeichnet ist, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel (I), einem Tautomer von (I) und/oder mit einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von (I) oder dessen Tautomer behandelt.

WO 2006/000436 A1



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, LI, 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
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

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.

Triazolopyrimidin-Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidin-Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie Pflanzenschutzmittel, die derartige Verbindungen als wirksamen Bestandteil enthalten.

- 10 Die EP-A 71792, US 5,994,360, EP-A 550113, WO-A 94/20501, EP-A 834 513, WO-A 98/46808 und WO 03/080615 beschreiben fungizid wirksame Triazolo[1,5a]pyrimidine, die in der 6-Position des Azolopyrimidinrings eine gegebenenfalls substituierte Phenylgruppe und in der 7-Position NH₂ oder eine primäre oder sekundäre Aminogruppe tragen.

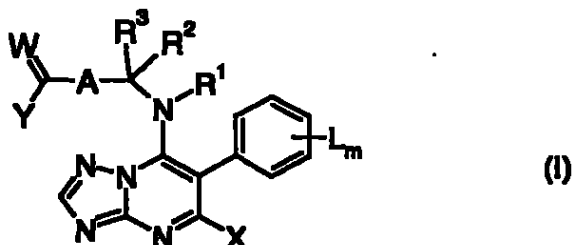
15

Die aus dem Stand der Technik bekannten Triazolopyrimidine mit einer Aminogruppe in der 7-Position sind hinsichtlich ihrer fungiziden Wirkung teilweise nicht zufriedenstellend oder besitzen unerwünschte Eigenschaften, wie eine geringe Nutzpflanzenverträglichkeit.

20

Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit besserer fungizider Wirksamkeit und/oder einer besseren Nutzpflanzenverträglichkeit bereitzustellen.

- 25 Diese Aufgabe wird überraschenderweise gelöst durch Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin:

30

X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht;

W Sauerstoff oder Schwefel bedeutet;

35

- Y für O-R⁴ oder eine Gruppe NR⁵R⁶ steht;
- A für eine chemische Bindung oder eine Gruppe CR⁷R⁸ steht;
- 5 L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, Nitro, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(=O)_nA¹ oder C(=O)A² bedeutet, worin
- R unabhängig voneinander C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl bedeutet;
- 10 A¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, NH₂, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino bedeutet;
- n 0, 1 oder 2 bedeutet;
- 15 A² C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy, Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, NH₂, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino bedeutet;
- m für 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5 steht;
- 20 R¹ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Formyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy carbonyl bedeutet oder gemeinsam mit R² für C₃-C₈-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3, oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;
- 25 R^a: Halogen, OH, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy carbonyl;
- R² Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, das einen Rest R^b aufweisen kann, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl, das gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Reste R^c trägt, bedeutet;
- 30 R^b: OR⁹, SR¹⁰, NR¹¹R¹², COOR¹³, CONR¹⁴R¹⁵, NHC(=NR¹⁶)NR¹⁴R¹⁵, Phenyl, das gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Reste R⁹ trägt, 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, das 1 Stickstoffatom und gegebenenfalls 1 oder 2 weitere, unter O, S und N ausgewählte Heteroatome als Ringglieder aufweist und das gegebenenfalls 1 oder 2 Reste R^b trägt oder einen ankondensierten Phenylring aufweisen kann, der seinerseits 1 oder 2 Reste R^b aufweisen kann, oder für C₃-C₈-Cycloalkyl steht;
- 35 R^c: Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, OH, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy carbonyl;
- 40

- R³** Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy bedeutet oder gemeinsam mit R² für C₂-C₆-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;
- R⁴** Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Halogenocycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl bedeutet, wobei Phenyl in den beiden letztgenannten Resten 1, 2 oder 3 der nachfolgenden Substituenten R^d aufweisen kann:
- R^d:** Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, C₁-C₄-Dialkylaminocarbonyl,
- oder R^d mit einem der Reste R¹, R², R³ oder R⁷ für C₂-C₆-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 Reste, ausgewählt unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;
- R⁵, R⁶** unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl stehen oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden, sind einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclen bilden, der gegebenenfalls ein weiteres, unter O, S und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweist und der gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen trägt,
- oder einer der Reste R⁵ oder R⁶ mit einem der Reste R¹, R², R³ oder R⁷ für C₂-C₆-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 Reste, ausgewählt unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;
- R⁷, R⁸** unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy bedeuten oder einer der Reste R⁷ oder R⁸ gemeinsam mit einem der Reste R¹ oder R² für C₂-C₆-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3, oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;

R^9 Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, Formyl oder C_1-C_8 -Alkylcarbonyl bedeutet;

R^{10} Wasserstoff oder C_1-C_4 -Alkyl bedeutet;

5

R^{11} , R^{12} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl stehen oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus bilden, der gegebenenfalls ein weiteres, unter O, S und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweist und der gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C_1-C_4 -Alkylgruppen trägt, wobei einer der Reste R^{11} , R^{12} auch für Formyl, C_1-C_8 -Alkylcarbonyl oder C_1-C_8 -Alkylthiocarbonyl stehen kann;

10

R^{13} Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, Hydroxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, Hydroxy- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_8 -Halogenalkyl, C_2-C_8 -Alkenyl, C_2-C_8 -Halogenalkenyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Halogencycloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkenyl, Phenyl, Phenyl- C_1-C_4 -alkyl, wobei Phenyl in den beiden letztgenannten Resten 1, 2 oder 3 der zuvor genannten Substituenten R^d aufweisen kann;

15

20

R^{14} , R^{15} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl stehen oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus bilden, der gegebenenfalls ein weiteres, unter O, S und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweist und der gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C_1-C_4 -Alkylgruppen trägt;

25

R^{16} Wasserstoff oder C_1-C_4 -Alkyl bedeutet;

30 und durch die landwirtschaftlich verträglichen Salze der Verbindungen I.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind somit die Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I und deren landwirtschaftlich verträglichen Salze.

35 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung der Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I, ihrer Tautomere und deren landwirtschaftlich verträglichen Salze zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (=Schadpilzen) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, das dadurch gekennzeichnet ist, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen

40

5

Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I, einem Tautomer von I und/oder mit einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I oder dessen Tautomer behandelt.

- 5' Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind das Weiteren Mittel zur Bekämpfung von Schädlingen, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I, ein Tautomer von I und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz davon oder von dessen Tautomer und wenigstens einen flüchtigen oder festen Trägerstoff.

- 10 Die Verbindungen der Formel I und deren Tautomere können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als reine Enantiomere oder reine Diastereomere oder als Enantiomeren- oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere als auch deren Gemische.

- 15 Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewöhnlichfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

- 30 Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluoroarsilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

- 35 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Variablen werden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die jeweiligen Substituenten stehen. Die Bedeutung C_n-C_m gibt die jeweils mögliche Anzahl von Kohlenstoffatomen in dem jeweiligen Substituenten oder Substituententeil an:

6

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl sowie alle Alkylteile in Alkoxy, Alkylthio, Alkoxyalkyl, Alkoxyalkoxy, Alkylamino und Dialkylamino: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, bis 6, bis 8 oder bis 10 Kohlenstoffatomen, z. B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halo(gen)alkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 oder bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z. B. C₁-C₆-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl und 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

Alkenyl: einfach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, bis 6 bis 8, oder bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl,

34

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

5

Alkadienyl: zweifach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4 bis 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in einer beliebigen Position z.B. 1,3-Butadienyl, 1-Methyl-1,3-butadienyl, 2-Methyl-1,3-butadienyl, Penta-1,3-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-3-yl, Hexa-1,4-dien-6-yl,

10

Hexa-1,5-dien-1-yl, Hexa-1,5-dien-3-yl, Hexa-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,4-dien-1-yl, Hepta-1,4-dien-3-yl, Hepta-1,4-dien-6-yl, Hepta-1,4-dien-7-yl, Hepta-1,5-dien-1-yl, Hepta-1,5-dien-3-yl, Hepta-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,5-dien-7-yl, Hepta-1,6-dien-1-yl, Hepta-1,6-dien-3-yl, Hepta-1,6-dien-4-yl, Hepta-1,6-dien-5-yl, Hepta-1,6-dien-2-yl,

15

Octa-1,4-dien-1-yl, Octa-1,4-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-3-yl, Octa-1,4-dien-6-yl, Octa-1,4-dien-7-yl, Octa-1,5-dien-1-yl, Octa-1,5-dien-3-yl, Octa-1,5-dien-4-yl, Octa-1,5-dien-7-yl, Octa-1,6-dien-1-yl, Octa-1,6-dien-3-yl, Octa-1,6-dien-4-yl, Octa-1,6-dien-5-yl, Octa-1,6-dien-2-yl, Deca-1,4-dienyl, Deca-1,5-dienyl, Deca-1,6-dienyl, Deca-1,7-dienyl, Deca-1,8-dienyl, Deca-2,5-dienyl, Deca-2,6-dienyl, Deca-2,7-dienyl, Deca-2,8-dienyl und dergleichen;

20

Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 2 bis 6, 2 bis 8 oder 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_8 -Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl,

25

3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl,

30

2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8, vorzugsweise bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

35

Cycloalkenyl: monocyclische, einfach ungesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8, vorzugsweise bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopenten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclohexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl und Cyclohexen-4-yl;

40

1a

Bicycloalkyl: bicyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 5 bis 10 C-Atomen wie Bicyclo[2.2.1]hept-1-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-7-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-1-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-2-yl, Bicyclo[3.3.0]octyl und Bicyclo[4.4.0]decyl;

- 5 **Alkylamino:** für einen über eine NH-Gruppe gebundene Alkylgruppe, worin Alkyl für einen der zuvor genannten Alkylreste mit in der Regel 1 bis 6 und insbesondere 1 bis 4 C-Atomen steht, wie Methylamino, Ethylamino, n-Propylamino, Isopropylamino, n-Butylamino und dergleichen;
- 10 **Dialkylamino:** für einen Rest der Formel $N(\text{Alkyl})_2$, worin Alkyl für einen der zuvor genannten Alkylreste mit in der Regel 1 bis 6 und insbesondere 1 bis 4 C-Atomen steht, z. B. für Dimethylamino, Diethylamino, Methylethylamino, N-Methyl-N-propylamino und dergleichen,
- 15 **C₁-C₄-Alkoxy:** für eine über ein Sauerstoff gebundene Alkylgruppe mit 1 bis 4 C-Atomen: z. B. Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder 1,1-Dimethylethoxy;
- 20 **C₁-C₆-Alkoxy:** für C₁-C₄-Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy,
- 25 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 30 **C₁-C₄-Halogenalkoxy:** für einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod, vorzugsweise durch Fluor substituiert ist, also z. B. OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy,
- 35 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder Nonfluorbutoxy;
- 40 **C₁-C₆-Halogenalkoxy:** für C₁-C₄-Halogenalkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpen-

toxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy oder Dodecafluorhexoxy;

Alkenyloxy: Alkenyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z. B. C_2-C_6 -Alkenyloxy wie Vinyloxy, 1-Propenyloxy, 2-Propenyloxy, 1-Methylethenyloxy, 1-Butenyloxy, 2-Butenyloxy, 3-Butenyloxy, 1-Methyl-1-propenyloxy, 2-Methyl-1-propenyloxy, 1-Methyl-2-propenyloxy, 2-Methyl-2-propenyloxy, 1-Pentenyloxy, 2-Pentenyloxy, 3-Pentenyloxy, 4-Pentenyloxy, 1-Methyl-1-butenyloxy, 2-Methyl-1-butenyloxy, 3-Methyl-1-butenyloxy, 1-Methyl-2-butenyloxy, 2-Methyl-2-butenyloxy, 3-Methyl-2-butenyloxy, 1-Methyl-3-butenyloxy, 2-Methyl-3-butenyloxy, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-1-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-propenyloxy, 1-Ethyl-2-propenyloxy, 1-Hexenyloxy, 2-Hexenyloxy, 3-Hexenyloxy, 4-Hexenyloxy, 5-Hexenyloxy, 1-Methyl-1-pentenyloxy, 2-Methyl-1-pentenyloxy, 3-Methyl-1-pentenyloxy, 4-Methyl-1-pentenyloxy, 1-Methyl-2-pentenyloxy, 2-Methyl-2-pentenyloxy, 3-Methyl-2-pentenyloxy, 4-Methyl-2-pentenyloxy, 1-Methyl-3-pentenyloxy, 2-Methyl-3-pentenyloxy, 3-Methyl-3-pentenyloxy, 4-Methyl-3-pentenyloxy, 1-Methyl-4-pentenyloxy, 2-Methyl-4-pentenyloxy, 3-Methyl-4-pentenyloxy, 4-Methyl-4-pentenyloxy, 1,1-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,1-Dimethyl-3-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-3-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 2,2-Dimethyl-3-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-1-butenyloxy, 1-Ethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-3-butenyloxy, 2-Ethyl-1-butenyloxy, 2-Ethyl-2-butenyloxy, 2-Ethyl-3-butenyloxy, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyloxy und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyloxy;

Alkynyloxy: Alkynyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z.B. C_3-C_6 -Alkynyloxy wie 2-Propinyloxy, 2-Butinyloxy, 3-Butinyloxy, 1-Methyl-2-propinyloxy, 2-Pentinyloxy, 3-Pentinyloxy, 4-Pentinyloxy, 1-Methyl-2-butinyloxy, 1-Methyl-3-butinyloxy, 2-Methyl-3-butinyloxy, 1-Ethyl-2-propinyloxy, 2-Hexinyloxy, 3-Hexinyloxy, 4-Hexinyloxy, 5-Hexinyloxy, 1-Methyl-2-pentinyloxy, 1-Methyl-3-pentinyloxy und dergleichen;

Alkylen: für eine lineare gesättigte Kohlenwasserstoffkette mit 2 bis 6 und insbesondere 2 bis 4 C-Atomen wie Ethan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Butan-1,4-diyl, Pentan-1,5-diyl oder Hexan-1,6-diyl;

1a

fünf- oder sechsgliedriger gesättigter oder partiell ungesättigter Heterocyclius, enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder: z.B. mono- und bicyclische Heterocyclen (Heterocycli) enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z. B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 1-Pyrrolidinyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isioxazolidinyl, 4-Isioxazolidinyl, 5-Isioxazolidinyl, 3-Isiothiazolidinyl, 4-Isiothiazolidinyl, 5-Isiothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isioxazolin-3-yl, 3-Isioxazolin-3-yl, 4-Isioxazolin-3-yl, 2-Isioxazolin-4-yl, 3-Isioxazolin-4-yl, 4-Isioxazolin-4-yl, 2-Isioxazolin-5-yl, 3-Isioxazolin-5-yl, 4-Isioxazolin-5-yl, 2-Isiothiazolin-3-yl, 3-Isiothiazolin-3-yl, 4-Isiothiazolin-3-yl, 2-Isiothiazolin-4-yl, 3-Isiothiazolin-4-yl, 4-Isiothiazolin-4-yl, 2-Isiothiazolin-5-yl, 3-Isiothiazolin-5-yl, 4-Isiothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 1-Piperidinyl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 4-Morpholinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl sowie die entsprechenden -yliden-Reste;

siebengliedriger gesättigter oder partiell ungesättigter Heterocyclius, enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder: z. B. mono- und bicyclische Heterocyclen mit 7 Ringgliedern, enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefel-

- atome, beispielsweise Tetra- und Hexahydroazepinyl wie 2,3,4,5-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 3,4,5,6-Tetrahydro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,4,7-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,6,7-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, Hexahydroazepin-1-, -2-, -3- oder -4-yl, Tetra- und Hexahydrooxepinyl wie 2,3,4,5-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,4,7-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,6,7-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, Hexahydroazepin-1-, -2-, -3- oder -4-yl, Tetra- und Hexahydro-1,3-diazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,4-diazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,3-oxazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,4-oxazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,3-dioxepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,4-dioxepinyl und die entsprechenden -ylden-Reste;
- fünf- oder sechsgliedriger aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel: ein- oder zweikerniges Heteroaryl, z. B. C-gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl; über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, 1,2,3-Triazol-1-yl und 1,2,4-Triazol-1-yl; 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl.

Im Hinblick auf die Verwendung als Fungizide sind solche Verbindungen der Formel I bevorzugt, worin die Variablen und X, A, W, R¹, R², R³, m und L unabhängig voneinander und insbesondere in Kombination die folgenden Bedeutungen aufweisen:

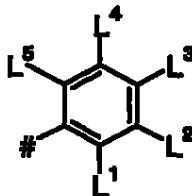
- X Halogen, speziell Chlor, oder C₁-C₄-Alkyl, speziell Methyl, besonders bevorzugt Halogen und ganz besonders bevorzugt Chlor;
- A eine chemische Bindung oder CH₂, insbesondere eine chemische Bindung;
- W Sauerstoff;

12

- R¹** Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, oder R¹ bildet mit R² eine lineare oder verzweigte C₂-C₈-Alkylengruppe, insbesondere eine lineare C₂-C₄-Alkylengruppe;
- R²** C₂-C₈-Alkyl, Trifluormethyl oder eine Gruppe (CH₂)_k-R^b bedeutet, worin k für 1 oder 2 steht und R^b die zuvor genannten Bedeutungen aufweist;
- R³** Wasserstoff;
- m** 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 1, 2 oder 3;
- L** Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy oder C₁-C₈-Alkoxycarbonyl, insbesondere Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, besonders bevorzugt Fluor, Chlor, C₁-C₂-Alkyl wie Methyl oder Ethyl, C₁-C₂-Fluoralkyl wie Trifluormethyl, C₁-C₂-Alkoxy wie Methoxy oder C₁-C₂-Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl. Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen wenigstens eine Gruppe L in ortho-Position zu der Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst angeordnet ist.
- In einer bevorzugten Ausführungsform steht Y für eine Gruppe O-R⁴, worin R⁴ die zuvor genannten Bedeutungen aufweist. Insbesondere steht hierin R⁴ für C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl oder C₃-C₄-Alkenyl und insbesondere für H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Methoxyethyl, 2-Ethoxyethyl oder 2-Propenyl (= Allyl). In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht Y für eine Gruppe O-R⁴, worin R⁴ mit dem Rest R² für eine C₂-C₄-Alkylengruppe steht.
- In einer anderen bevorzugten Ausführungsform steht Y für eine Gruppe N-R⁵R⁶, worin R⁵, R⁶ die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen. Insbesondere steht hierin R⁵ für H, C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₄-Alkenyl und insbesondere für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder n-Propenyl. R⁶ steht insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₄-Alkenyl und insbesondere für H, Methyl, Ethyl oder n-Propyl. R⁵ and R⁶ können auch mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten 5- bis 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus bilden, der gegebenenfalls ein weiteres unter O, S und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweisen kann und der gegebenenfalls 1 bis 4 Methylgruppen aufweisen kann: z. B. steht dann Y für 1-Pyrrolidiny, 1-Piperidiny, 4-Morpholiny, 4-Thiomorpholiny oder 4-Methylpiperazin-1-yl. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform steht Y für eine Gruppe N-R⁵R⁶, worin R⁵ mit dem Rest R² für eine C₂-C₄-Alkylengruppe steht und R⁶ Wasserstoff bedeutet.

73

Unter den Verbindungen der Formel I sind besonders solche bevorzugt, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für die Gruppe der Formel



5

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

L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ;

L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor oder Fluor, wobei L^4 auch für NO_2 stehen kann;

10 L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, NO_2 , C_1-C_4 -Alkyl, speziell CH_3 , C_1-C_4 -Alkoxy, speziell OCH_3 , oder $CO(A^2)$, worin A^2 für OH, C_1-C_4 -Alkoxy, speziell OCH_3 , NH_2 , C_1-C_4 -Alkylamino steht; und

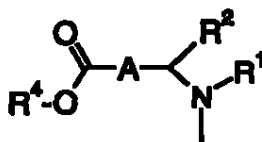
L^5 Wasserstoff, Fluor, Chlor, oder C_1-C_4 -Alkyl, speziell CH_3 , bedeuten.

15 Unter den Verbindungen I sind insbesondere solche bevorzugt, worin für R^1 Wasserstoff steht oder R^1 mit R^2 eine lineare oder verzweigte C_2-C_6 -Alkylengruppe, insbesondere eine lineare C_2-C_6 -Alkylengruppe bildet. Hierin steht R^2 insbesondere für Wasserstoff.

20 Besonders bevorzugt sind auch solche Verbindungen der Formel I, worin R^2 für C_2-C_6 -Alkyl steht. Hierin steht R^2 insbesondere für Wasserstoff. R^1 steht dann ebenfalls insbesondere für Wasserstoff.

Hierunter sind solche Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, worin R^2 für Wasserstoff steht, W Sauerstoff bedeutet und Y für eine Gruppe OR^4 steht, welche die vorgenannten Bedeutungen und insbesondere die bevorzugten Bedeutungen aufweist, und die Reste R^1 und R^2 denen der folgenden Aminosäuren entsprechen: Prolin, Pipicolinsäure, Leucin, Isoleucin, Methionin, Phenylalanin, Tyrosin und Valin. Mit anderen

30



Ist von einer der vorgenannten α -Aminosäuren oder einem Ester, insbesondere einem C_1-C_4 -Alkylester oder eine C_2-C_4 -Alkenylester davon abgeleitet.

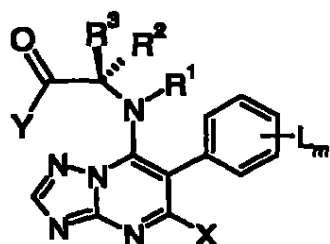
Eine andere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen I, worin R^2 eine Gruppe $(CH_2)_k R^b$ bedeutet, worin k für 1 oder 2 steht und R^b die zuvor genannten Bedeutungen aufweist. Hierin steht R^3 insbesondere für Wasserstoff. R^1 steht dann ebenfalls insbesondere für Wasserstoff. Hierin hat R^b insbesondere die folgenden Bedeutungen: Phenyl, 4-Hydroxyphenyl, 3,4-Dihydroxyphenyl, Imidazol-4-yl, Indol-3-yl, 5-Hydroxyindol-3-yl, C₁-C₄-Alkylthio, speziell S-CH₃, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl.

10 Sofern Y in Formel I für eine Gruppe NR^5R^6 steht, haben R^5 und R^6 unabhängig voneinander die folgenden Bedeutungen: H oder C₁-C₄-Alkyl.

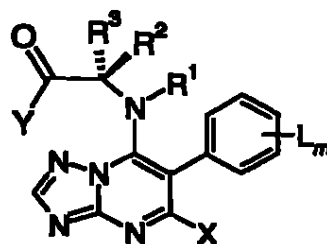
In den Gruppen OR^9 , SR^{10} , $NR^{11}R^{12}$, $C(O)OR^{13}$, $CONR^{14}R^{15}$ und $C(=N-R^{16})NR^{14}R^{16}$, $NHC(W)R^{16}$, $C(W)R^{17}$ und $NR^{18}R^{19}$ haben die Variablen insbesondere die im Folgenden angegebenen Bedeutungen:

R^9 steht insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl, C(O)H oder C₁-C₄-Alkylcarbonyl;
 R^{10} steht insbesondere für H oder C₁-C₄-Alkyl;
 R^{11} und R^{12} stehen insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl oder C₁-C₄-Alkyl(thiocarbonyl). Insbesondere steht $NR^{11}R^{12}$ für NH₂, NHCH₃, NHC₂H₅, N(CH₃)₂, N(C₂H₅)CH₃, NHC(O)CH₃ oder NHC(O)H.
 R^{13} steht insbesondere für C₁-C₄-Alkyl.
 R^{14} steht insbesondere für H oder C₁-C₄-Alkyl.
 R^{15} steht insbesondere für H oder C₁-C₄-Alkyl.
 R^{16} steht insbesondere für H oder C₁-C₄-Alkyl.
 R^{18} steht insbesondere für H oder C₁-C₄-Alkyl.

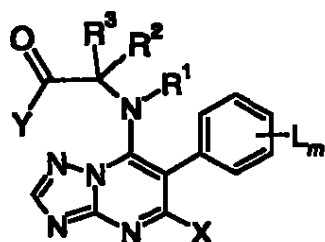
Beispiele für bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel I sind die in den nachfolgenden Tabellen 1 bis 80 angegebenen Enantiomere der Formeln I-L und I-D sowie das Racemat der Formel I-R, worin die Variablen R^1 , R^2 , R^3 und Y jeweils gemeinsam die in einer der Zellen 1 bis 814 der Tabelle A angegebene Bedeutung haben:



(I-L)



(I-D)



(I-R)

Tabelle 1

5 Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 2

10 Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

15 Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dichlor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 4

20 Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-methyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

25 Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trifluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 6

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methoxy bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 7

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m Pentafluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 8

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 9

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 10

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Methoxy-6-fluor bedeuten und die Kombination von für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 11

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 12

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 13

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,4-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 14

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-4-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 15

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Chlor-4-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 16

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,3-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 17

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,5-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 18

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,3,4-Trifluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 19

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 20

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,4-Dimethyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 21

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl-4-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 22

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 23

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dimethyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 24

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trimethyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 25

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-cyano bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 26

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 27

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 28

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 29

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 30

Verbindungen der Formeln I-D, I-L und I-R, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 31

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Fluor-6-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 32

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 33

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Dichlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 34

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Fluor-6-methyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 35

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,4,6-Trifluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 36

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-methoxy bedeuten und die Kombination von für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 37

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m Pentafluor bedeuten und die Kombination von für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 38

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Methyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 39

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 40

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Methoxy-6-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 41

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 42

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 43

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,4-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 44

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Fluor-4-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 45

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Chlor-4-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 46

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,3-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 47

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,5-Difluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 48

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,3,4-Trifluor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 49

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Methyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 50

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,4-Dimethyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 51

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Methyl-4-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 52

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Fluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 53

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Dimethyl bedeuten und die Kombination von Y, R^1 , R^2 und R^3 für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

40

22

Tabelle 54

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,4,6-Trimethyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 55

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-cyano bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 56

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-methyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 57

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 58

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Trifluormethyl-4-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 59

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 60

Verbindungen der Formeln I-L, I-D und I-R, in denen X Methyl, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor bedeuten und die Kombination von Y, R¹, R² und R³ für eine Verbindung jeweils einer Zelle der Tabelle A entspricht

35

Tabelle A:

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
1	H	H	H	OH
2	H	Phenyl	H	OH

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
3	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OH
4	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OH
5	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OH
6	H	CH ₂ -Phenyl	H	OH
7	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OH
8	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OH
9	H	CH ₃	H	OH
10	H	CH(CH ₃) ₂	H	OH
11	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OH
12	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OH
13	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OH
14	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OH
15	H	CH ₂ -SH	H	OH
16	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OH
17	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OH
18	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OH
19	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OH
20	H	CH ₂ -CO-OH	H	OH
21	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OH
22	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OH
23	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OH
24	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OH
25	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OH
26	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OH
27	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OH
28	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OH
29	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OH
30	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OH
31	H	CH ₂ -OH	H	OH
32	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OH

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
33	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OH
34	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OH
35	H	CHCH ₃ -OH	H	OH
36	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OH
37	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OH
38	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OH
39		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OH
40		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OH
41		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OH
42	H	CH ₂ CH ₂		OH
43	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OH
44	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OH
45	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OH
46	H	H	H	OCH ₃
47	H	Phenyl	H	OCH ₃
48	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₃
49	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₃
50	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₃
51	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₃
52	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₃
53	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₃
54	H	CH ₃	H	OCH ₃
55	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
56	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
57	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
58	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
59	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
60	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₃
61	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₃
62	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
63	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃
64	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
65	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
66	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
67	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
68	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
69	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
70	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
71	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
72	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
73	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
74	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
75	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
76	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₃
77	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₃
78	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
79	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
80	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₃
81	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₃
82	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
83	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
84		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₃
85		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₃
86		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₃
87	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₃
88	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
89	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
90	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
91	H	H	H	OCH ₂ CH ₃
92	H	Phenyl	H	OCH ₂ CH ₃

53

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
93	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH ₃
94	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₂ CH ₃
95	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₂ CH ₃
96	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH ₃
97	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₂ CH ₃
98	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₂ CH ₃
99	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
100	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
101	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
102	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
103	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
104	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
105	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
106	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
107	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
108	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
109	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
110	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
111	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
112	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
113	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
114	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
115	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
116	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
117	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
118	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
119	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
120	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
121	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
122	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
123	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
124	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
125	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
126	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
127	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
128	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
129		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
130		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
131		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
132	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
133	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
134	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
135	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
136	H	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
137	H	Phenyl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
138	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
139	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
140	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
141	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
142	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
143	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
144	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
145	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
146	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
147	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
148	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
149	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
150	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
151	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
152	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃

55 89

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
153	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
154	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
155	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
156	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
157	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
158	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
159	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
160	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
161	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
162	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
163	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
164	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
165	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
166	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
167	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
168	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
169	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
170	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
171	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
172	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
173	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
174		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
175		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
176		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
177	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
178	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
179	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
180	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
181	H	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
182	H	Phenyl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
183	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
184	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
185	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
186	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
187	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
188	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
189	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
190	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
191	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
192	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
193	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
194	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
195	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
196	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
197	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
198	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
199	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
200	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
201	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
202	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
203	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
204	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
205	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
206	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
207	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
208	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
209	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
210	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
211	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
212	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃

5758

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
213	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
214	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
215	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
216	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
217	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
218	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
219		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
220		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
221		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
222	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
223	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
224	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
225	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
226	H	H	H	OC(CH ₃) ₃
227	H	Phenyl	H	OC(CH ₃) ₃
228	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OC(CH ₃) ₃
229	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OC(CH ₃) ₃
230	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OC(CH ₃) ₃
231	H	CH ₂ -Phenyl	H	OC(CH ₃) ₃
232	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OC(CH ₃) ₃
233	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OC(CH ₃) ₃
234	H	CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
235	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
236	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
237	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
238	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
239	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
240	H	CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
241	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
242	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃

58 SF

31

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
243	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
244	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
245	H	CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
246	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
247	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
248	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
249	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
250	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
251	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
252	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
253	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
254	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
255	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
256	H	CH ₂ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
257	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
258	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
259	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
260	H	CHCH ₃ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
261	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
262	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
263	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
264		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
265		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
266		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
267	H	CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
268	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
269	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
270	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
271	H	H	H	OCH(CH ₃) ₂
272	H	Phenyl	H	OCH(CH ₃) ₂

59 58

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
273	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH(CH ₃) ₂
274	H	CH ₂ -(5-HydroxyIndol-3-yl)	H	OCH(CH ₃) ₂
275	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH(CH ₃) ₂
276	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH(CH ₃) ₂
277	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH(CH ₃) ₂
278	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH(CH ₃) ₂
279	H	CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
280	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
281	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
282	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
283	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
284	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
285	H	CH ₂ -SH	H	OCH(CH ₃) ₂
286	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH(CH ₃) ₂
287	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
288	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
289	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
290	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH(CH ₃) ₂
291	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
292	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH(CH ₃) ₂
293	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
294	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
295	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
296	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH(CH ₃) ₂
297	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
298	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH(CH ₃) ₂
299	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
300	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
301	H	CH ₂ -OH	H	OCH(CH ₃) ₂
302	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
303	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
304	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
305	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH(CH ₃) ₂
306	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
307	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
308	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
309		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
310		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
311		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
312	H	CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
313	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
314	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
315	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
316	H	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
317	H	Phenyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
318	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
319	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
320	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
321	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
322	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
323	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
324	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
325	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
326	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
327	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
328	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
329	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
330	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
331	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
332	H	CH ₂ -SCH ₃		OCH ₂ CH=CH ₂

61 (60)

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
333	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
334	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
335	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
336	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
337	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
338	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
339	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
340	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
341	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
342	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
343	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
344	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
345	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
346	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
347	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
348	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
349	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
350	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
351	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
352	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
353	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
354		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
355		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
356		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
357	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
358	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
359	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
360	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
361	H	H	H	NHCH ₃
362	H	Phenyl	H	NHCH ₃

6261

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
363	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	NHCH ₃
364	H	CH ₂ -(5-HydroxyIndol-3-yl)	H	NHCH ₃
365	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	NHCH ₃
366	H	CH ₂ -Phenyl	H	NHCH ₃
367	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	NHCH ₃
368	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	NHCH ₃
369	H	CH ₃	H	NHCH ₃
370	H	CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
371	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
372	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
373	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
374	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
375	H	CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
376	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
377	H	CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
378	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
379	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
380	H	CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
381	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
382	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
383	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
384	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
385	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
386	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
387	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
388	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
389	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
390	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
391	H	CH ₂ -OH	H	NHCH ₃
392	H	CH ₂ -OCH ₃	H	NHCH ₃

6362

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
393	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
394	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
395	H	CHCH ₃ -OH	H	NHCH ₃
396	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	NHCH ₃
397	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
398	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
399		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	NHCH ₃
400		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	NHCH ₃
401		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	NHCH ₃
402	H	CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
403	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
404	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
405	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
406	CH ₃	H	H	OCH ₃
407	CH ₃	Phenyl	H	OCH ₃
408	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₃
409	CH ₃	CH ₂ -(5-HydroxyIndol-3-yl)	H	OCH ₃
410	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₃
411	CH ₃	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₃
412	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₃
413	CH ₃	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₃
414	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
415	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
416	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
417	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
418	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
419	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
420	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OCH ₃
421	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₃
422	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃

61 83

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
423	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃
424	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
425	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
426	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
427	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
428	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
429	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
430	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
431	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
432	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
433	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
434	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
435	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
436	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OCH ₃
437	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₃
438	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
439	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
440	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₃
441	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₃
442	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
443	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
444	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OCH ₃
445	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
446	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
447	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
448	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
449	CH ₃	Phenyl	H	OCH ₂ CH ₃
450	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH ₃
451	CH ₃	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₂ CH ₃
452	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₂ CH ₃

65 64

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
453	CH ₃	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH ₃
454	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₂ CH ₃
455	CH ₃	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₂ CH ₃
456	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
457	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
458	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
459	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
460	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
461	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
462	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
463	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
464	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
465	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
466	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
467	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
468	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
469	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
470	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
471	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
472	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
473	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
474	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
475	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
476	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
477	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
478	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
479	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
480	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
481	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
482	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₃

66 65

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
483	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
484	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
485	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
486	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
487	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
488	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
489	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
490	CH ₃	H	H	OC(CH ₃) ₃
491	CH ₃	Phenyl	H	OC(CH ₃) ₃
492	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OC(CH ₃) ₃
493	CH ₃	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OC(CH ₃) ₃
494	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OC(CH ₃) ₃
495	CH ₃	CH ₂ -Phenyl	H	OC(CH ₃) ₃
496	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OC(CH ₃) ₃
497	CH ₃	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OC(CH ₃) ₃
498	CH ₃	CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
499	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
500	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
501	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
502	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
503	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
504	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
505	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
506	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
507	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
508	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
509	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
510	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
511	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
512	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
513	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
514	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
515	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
516	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
517	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
518	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
519	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
520	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
521	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
522	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
523	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
524	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
525	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
526	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
527	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
528	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
529	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
530	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
531	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
532	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
533	CH ₃	Phenyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
534	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
535	CH ₃	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
536	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
537	CH ₃	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
538	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
539	CH ₃	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
540	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
541	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
542	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂

68 57

57

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
543	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
544	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
545	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
546	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
547	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
548	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
549	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
550	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
551	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
552	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
553	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
554	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
555	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
556	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
557	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
558	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
559	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
560	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
561	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
562	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
563	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
564	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
565	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
566	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
567	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
568	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
569	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
570	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
571	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
572	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
573	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
574	CH ₃	H	H	NHCH ₃
575	CH ₃	Phenyl	H	NHCH ₃
576	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-yl	H	NHCH ₃
577	CH ₃	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	NHCH ₃
578	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	NHCH ₃
579	CH ₃	CH ₂ -Phenyl	H	NHCH ₃
580	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	NHCH ₃
581	CH ₃	CH ₂ -Cyclohexyl	H	NHCH ₃
582	CH ₃	CH ₃	H	NHCH ₃
583	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
584	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
585	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
586	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
587	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
588	CH ₃	CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
589	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
590	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
591	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
592	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
593	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
594	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
595	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
596	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
597	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
598	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
599	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
600	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
601	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
602	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
603	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
604	CH ₃	CH ₂ -OH	H	NHCH ₃
605	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	NHCH ₃
606	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
607	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
608	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	NHCH ₃
609	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	NHCH ₃
610	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
611	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
612	CH ₃	CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
613	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
614	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
615	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
616	CH ₃		H	NHCH ₃
617	H	H	CH ₂ CH ₂ O *	
618	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
619	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
620	H	H	CH ₂ CH ₂ NH *	
621	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
622	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
623	H	H	CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
624	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
625	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
626	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ O *	
627	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
628	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
629	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ NH *	
630	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
631	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
632	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
633	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
634	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
635	H	H	H	N(CH ₃) ₂
636	H	Phenyl	H	N(CH ₃) ₂
637	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	N(CH ₃) ₂
638	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	N(CH ₃) ₂
639	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	N(CH ₃) ₂
640	H	CH ₂ -Phenyl	H	N(CH ₃) ₂
641	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	N(CH ₃) ₂
642	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	N(CH ₃) ₂
643	H	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
644	H	CH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
645	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
646	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
647	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
648	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
649	H	CH ₂ -SH	H	N(CH ₃) ₂
650	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	N(CH ₃) ₂
651	H	CH ₂ -SCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
652	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
653	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	N(CH ₃) ₂
654	H	CH ₂ -CO-OH	H	N(CH ₃) ₂
655	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
656	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	N(CH ₃) ₂
657	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
658	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
659	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	N(CH ₃) ₂
660	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	N(CH ₃) ₂
661	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
662	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	N(CH ₃) ₂

72 77

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
663	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
664	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
665	H	CH ₂ -OH	H	N(CH ₃) ₂
666	H	CH ₂ -OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
667	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
668	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
669	H	CHCH ₃ -OH	H	N(CH ₃) ₂
670	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
671	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
672	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
673		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
674		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
675		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
676	H	CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
677	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
678	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
679	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
680	H	H	H	1-Pyrrolidinyl
681	H	Phenyl	H	1-Pyrrolidinyl
682	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	1-Pyrrolidinyl
683	H	CH ₂ -(5-HydroxyIndol-3-yl)	H	1-Pyrrolidinyl
684	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	1-Pyrrolidinyl
685	H	CH ₂ -Phenyl	H	1-Pyrrolidinyl
686	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	1-Pyrrolidinyl
687	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	1-Pyrrolidinyl
688	H	CH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
689	H	CH(CH ₃) ₂	H	1-Pyrrolidinyl
690	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	1-Pyrrolidinyl
691	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
692	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Pyrrolidinyl

372

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
693	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
694	H	CH ₂ -SH	H	1-Pyrrolidinyl
695	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	1-Pyrrolidinyl
696	H	CH ₂ -SCH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
697	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
698	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Pyrrolidinyl
699	H	CH ₂ -CO-OH	H	1-Pyrrolidinyl
700	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
701	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Pyrrolidinyl
702	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pyrrolidinyl
703	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Pyrrolidinyl
704	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Pyrrolidinyl
705	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	1-Pyrrolidinyl
706	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
707	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Pyrrolidinyl
708	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pyrrolidinyl
709	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Pyrrolidinyl
710	H	CH ₂ -OH	H	1-Pyrrolidinyl
711	H	CH ₂ -OCH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
712	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pyrrolidinyl
713	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Pyrrolidinyl
714	H	CHCH ₃ -OH	H	1-Pyrrolidinyl
715	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	1-Pyrrolidinyl
716	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pyrrolidinyl
717	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Pyrrolidinyl
718		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Pyrrolidinyl
719		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	1-Pyrrolidinyl
720		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Pyrrolidinyl
721	H	CH ₂ CH ₂		1-Pyrrolidinyl
722	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Pyrrolidinyl

57

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
723	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Pyrrolidinyl
724	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Pyrrolidinyl
725	H	H	H	1-Piperidinyl
726	H	Phenyl	H	1-Piperidinyl
727	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	1-Piperidinyl
728	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	1-Piperidinyl
729	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	1-Piperidinyl
730	H	CH ₂ -Phenyl	H	1-Piperidinyl
731	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	1-Piperidinyl
732	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	1-Piperidinyl
733	H	CH ₃	H	1-Piperidinyl
734	H	CH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinyl
735	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinyl
736	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Piperidinyl
737	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Piperidinyl
738	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Piperidinyl
739	H	CH ₂ -SH	H	1-Piperidinyl
740	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	1-Piperidinyl
741	H	CH ₂ -SCH ₃	H	1-Piperidinyl
742	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	1-Piperidinyl
743	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Piperidinyl
744	H	CH ₂ -CO-OH	H	1-Piperidinyl
745	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Piperidinyl
746	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Piperidinyl
747	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinyl
748	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinyl
749	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Piperidinyl
750	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	1-Piperidinyl
751	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Piperidinyl
752	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Piperidinyl

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
753	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinyl
754	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinyl
755	H	CH ₂ -OH	H	1-Piperidinyl
756	H	CH ₂ -OCH ₃	H	1-Piperidinyl
757	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinyl
758	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinyl
759	H	CHCH ₃ -OH	H	1-Piperidinyl
760	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	1-Piperidinyl
761	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinyl
762	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinyl
763		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Piperidinyl
764		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	1-Piperidinyl
765		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Piperidinyl
766	H	CH ₂ CH ₂		1-Piperidinyl
767	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Piperidinyl
768	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Piperidinyl
769	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Piperidinyl
770	H	H	H	Morpholin-4-yl
771	H	Phenyl	H	Morpholin-4-yl
772	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	Morpholin-4-yl
773	H	CH ₂ -(5-Hydroxyindol-3-yl)	H	Morpholin-4-yl
774	H	CH ₂ -(Imidazol-4-yl)	H	Morpholin-4-yl
775	H	CH ₂ -Phenyl	H	Morpholin-4-yl
776	H	CH ₂ -(4-OH-Phenyl)	H	Morpholin-4-yl
777	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	Morpholin-4-yl
778	H	CH ₃	H	Morpholin-4-yl
779	H	CH(CH ₃) ₂	H	Morpholin-4-yl
780	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Morpholin-4-yl
781	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Morpholin-4-yl
782	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Morpholin-4-yl

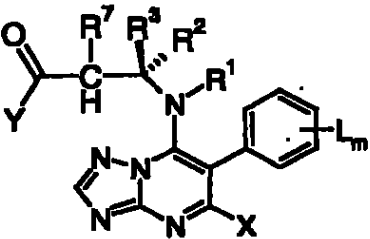
35
76

Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
783	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Morpholin-4-yl
784	H	CH ₂ -SH	H	Morpholin-4-yl
785	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	Morpholin-4-yl
786	H	CH ₂ -SCH ₃	H	Morpholin-4-yl
787	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	Morpholin-4-yl
788	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	Morpholin-4-yl
789	H	CH ₂ -CO-OH	H	Morpholin-4-yl
790	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	Morpholin-4-yl
791	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	Morpholin-4-yl
792	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	Morpholin-4-yl
793	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	Morpholin-4-yl
794	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	Morpholin-4-yl
795	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	Morpholin-4-yl
796	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	Morpholin-4-yl
797	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	Morpholin-4-yl
798	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	Morpholin-4-yl
799	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	Morpholin-4-yl
800	H	CH ₂ -OH	H	Morpholin-4-yl
801	H	CH ₂ -OCH ₃	H	Morpholin-4-yl
802	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	Morpholin-4-yl
803	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	Morpholin-4-yl
804	H	CHCH ₃ -OH	H	Morpholin-4-yl
805	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	Morpholin-4-yl
806	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	Morpholin-4-yl
807	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	Morpholin-4-yl
808		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Morpholin-4-yl
809		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	Morpholin-4-yl
810		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Morpholin-4-yl
811	H	CH ₂ CH ₂		Morpholin-4-yl
812	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		Morpholin-4-yl

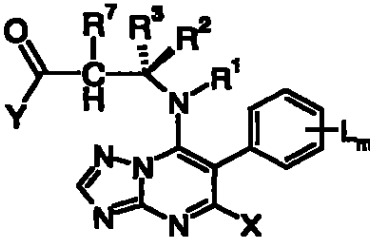
Nr.	R ¹	R ²	R ³	Y
813	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		Morpholin-4-yl
814	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		Morpholin-4-yl

* Das Heteroatom ist an das C-Atom der Carbonylgruppe gebunden

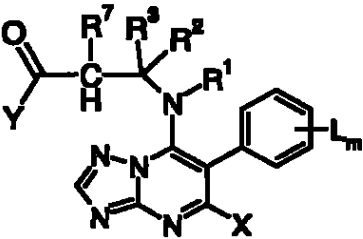
Beispiele für bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel I sind auch die Enantiomere der Formeln I-L' und I-D' sowie das Racemat der Formel I-R', worin R⁷ für Wasserstoff oder Methyl steht, X und L_m die in den Tabellen 1 bis 60 angegebenen Bedeutungen und die Variablen R¹, R², R³ und Y jeweils gemeinsam die in einer der Zellen 1 bis 814 der Tabelle A angegebene Bedeutung haben:



(I-L')



(I-D')



(I-R')

10 Beispiele für bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel I sind auch die Enantiomere der Formeln I-L'' und I-D'' sowie das Racemat der Formel I-R'', worin L_m und X die in den Tabellen 1 bis 60 angegebenen Bedeutungen und die Variable Y jeweils gemeinsam die in einer der Zellen 1 bis 18 der Tabelle A' angegebene Bedeutung hat:

15

7879

51

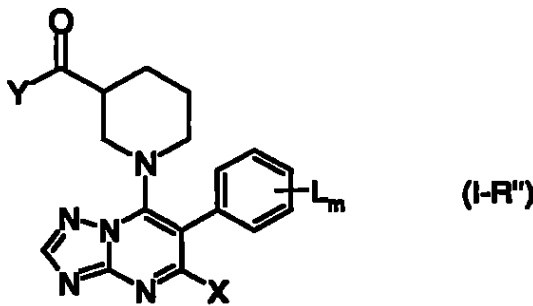
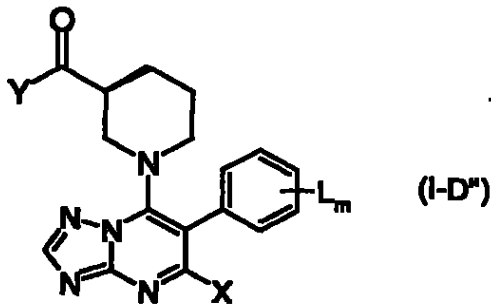
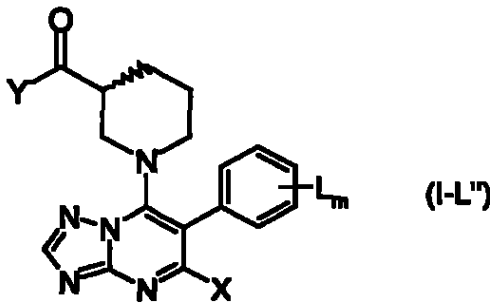
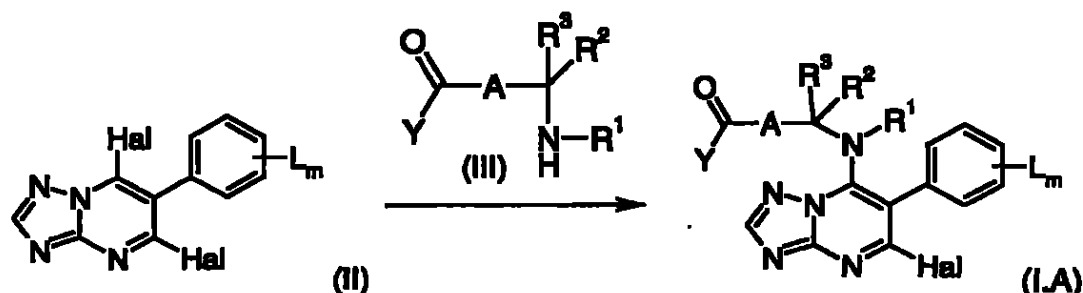


Tabelle A':

Nr.	Y
1	OH
2	OCH ₃
3	OCH ₂ CH ₃
4	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
5	OCH=CH-CH ₃
6	OCH(CH ₃) ₂
7	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
8	OC(CH ₃) ₃
9	OCH ₂ C ₆ H ₅
10	NH ₂
11	NHCH ₃
12	NHCH ₂ CH ₃
13	N(CH ₃) ₂
14	1-Pyrrolidinyl
15	1-Piperidinyl
16	Morpholin-4-yl

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Die Herstellung der Verbindungen I, worin X für Halogen und W für Sauerstoff stehen (Verbindungen I.A), erfolgt in der Regel durch Umsetzung von 5,7-Dihalogen-
 5 triazolopyrimidinen der allgemeinen Formel II mit Aminocarbonsäurederivaten der allgemeinen Formel III gemäß der in Schema 1 dargestellten Methode:

Schema 1:



10

In Schema 1 haben $R^1 - R^3$, L , m und Y die zuvor genannten Bedeutungen. Hal steht für Halogen, insbesondere Chlor. Die Umsetzung von II mit Aminocarbonsäurederivaten wird vorteilhaft bei 0 °C bis 70 °C, bevorzugt 10 °C bis 35 °C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie
 15 Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO 98/48608; WO 02/48151].

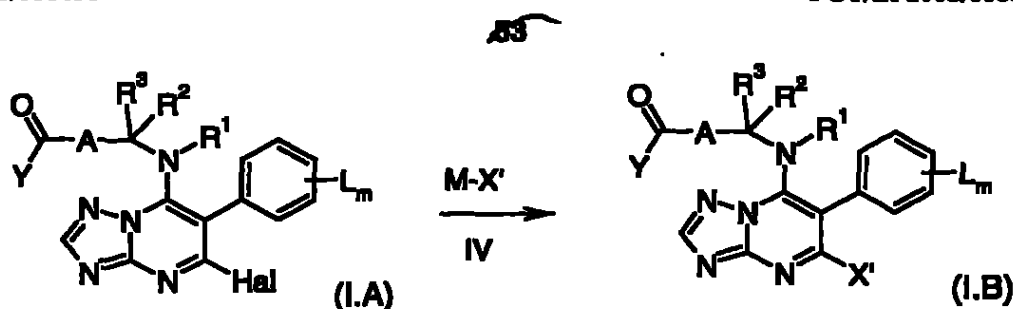
Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganischen Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssige Aminocarbonsäure der Formel III kann als Base dienen.

Die Aminosäurederivate der Formel III sind bekannt und größtenteils kommerziell verfügbar oder können nach bekannten Methoden zur Herstellung und Derivatisierung von Aminosäuren hergestellt werden. 5,7-Dihalogen-1,2,4-triazolopyrimidine der allgemeinen
 25 Formel II sind aus dem eingangs zitierten Stand der Technik bekannt oder können in Analogie zu den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden.

Verbindungen der Formel I, worin X Cyano oder C_1-C_4 -Alkoxy bedeutet (Formel I.B), können vorteilhaft aus Verbindungen I.A nach der in Schema 2 dargestellten Methode hergestellt werden.

30

Schema 2:

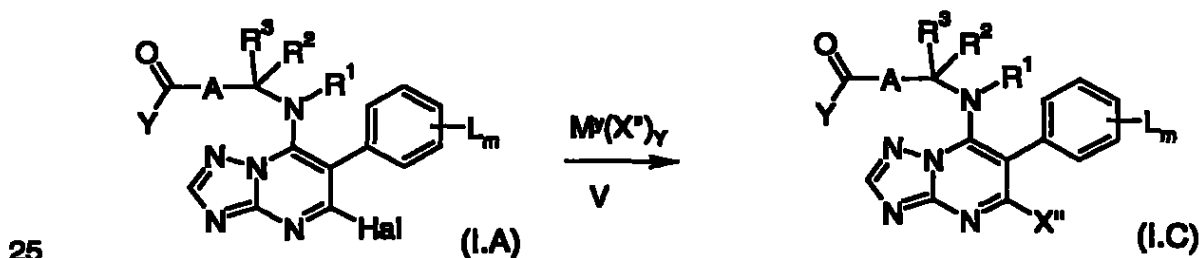


In Schema 2 haben $R^1 - R^3$, Hal, L, m und Y die zuvor genannten Bedeutungen. X' steht für Cyanid, C_1-C_4 -Alkoxyat oder C_1-C_4 -Halogenalkoxyat. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel IV hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt. Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120 °C, bevorzugt bei 10 bis 40 °C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)]. Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

Verbindungen I, in denen X für C_1-C_4 -Alkyl steht (Formel I.C), können vorteilhaft ausgehend von Ausgangsstoffen der Formel I.A auf den nachfolgend skizzierten Routen hergestellt werden.

Verbindungen der Formel I.C, in denen X'' C_1-C_4 -Alkyl bedeutet, können beispielsweise durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I.A, mit metallorganischen Reagenzien der Formel V erhalten werden (siehe Schema 3). In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt diese Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, z. B. in Gegenwart katalytisch wirksamer Mengen an Ni- oder Pd-Verbindungen.

Schema 3:

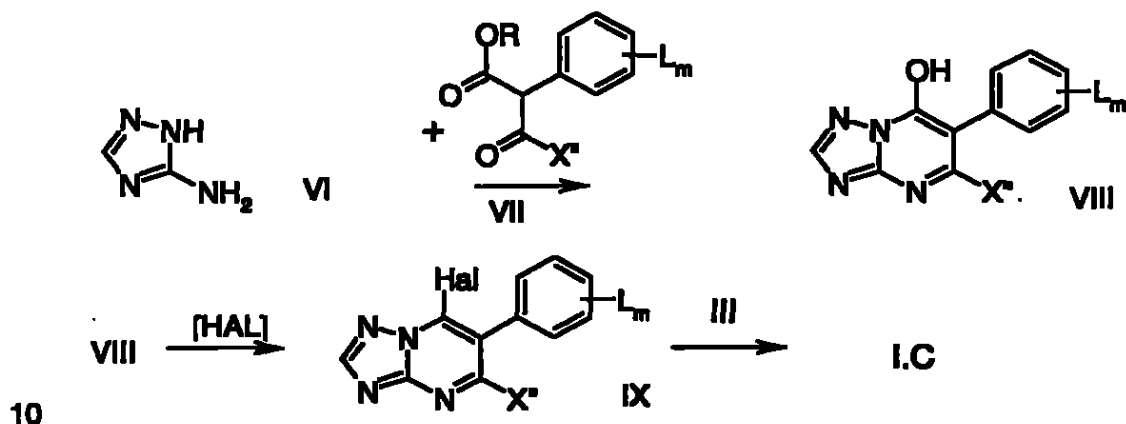


In den Formeln I.C und V steht X'' für C_1-C_4 -Alkyl und M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, S.733 (1990); J. Org.

Chem., Bd. 43, S.358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. S.868 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, S.8267 (1993); ebenda, Bd. 33, S.413 (1992).

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht (Formel I.C), können vorteilhaft auch auf folgendem, in Schema 4 dargestellten Syntheseweg hergestellt werden:

Schema 4:



- 15 In Schema 4 haben R¹ – R³, L, m und Y die zuvor genannten Bedeutungen. Hal steht insbesondere für Chlor oder Brom, X^a für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl und R steht für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

- 20 In einem ersten Schritt stellt man nach an sich bekannten Verfahren durch Umsetzung von 5-Aminotriazol VI mit dem Ketoester VII ein 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidin VIII her [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Das eingesetzte 5-Aminotriazol VI ist kommerziell erhältlich. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen VII erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 bekannten Bedingungen.

- 25 Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII werden in einem zweiten Schritt mit Halogenierungsmitteln [HAL] zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel IX umgesetzt. Bevorzugte Halogenierungsmittel sind Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxylbromid, Phosphoroxylchlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150 °C oder vorzugsweise von 80 bis 125 °C.

- 30 Die Umsetzung des 7-Halogenotriazolopyrimidin IX mit dem Aminocarbonsäurederivat der Formel III wird vorteilhaft bei 0 °C bis 70 °C, insbesondere 10 °C bis 35 °C durchgeführt. Vorzugsweise führt man die Umsetzung in Anwesenheit eines inerten Lö-

sungsmittels, wie einem Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, einem halogenierten Kohlenwasserstoff, wie Dichlormethan, einem aromatische Kohlenwasserstoff, wie beispielsweise Toluol, Xylole etc. durch [vgl. WO 98/46808].

5

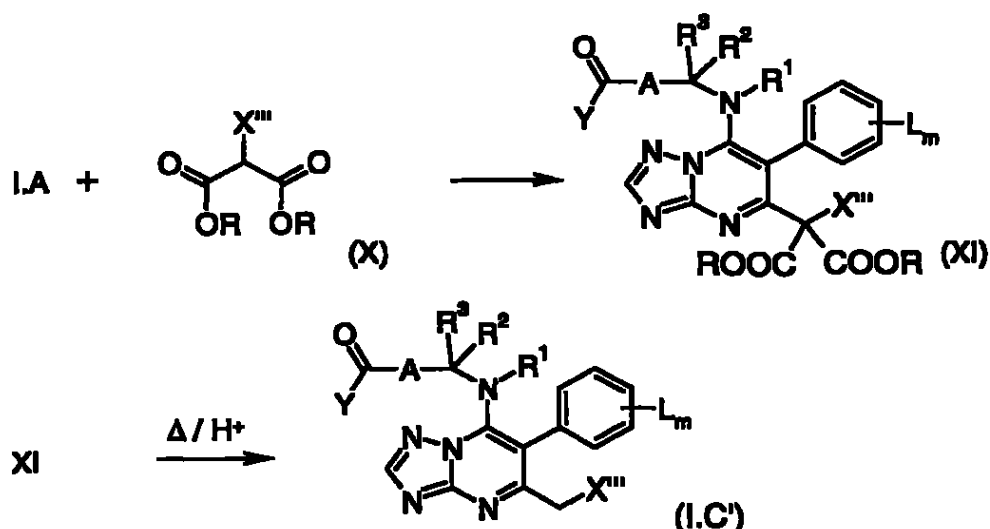
Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganischen Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amino-carbonsäurederivat der Formel III kann als Base dienen.

10

Verbindungen der Formel I.C, können alternativ auch durch Umsetzung von Verbindungen I.A und Malonsäuredialkylester der Formel X und anschließende Decarboxylierung nach der in Schema 5 dargestellten Methode hergestellt werden [vgl. US 5 994 360].

15

Schema 5:



20

In Schema 5 haben R¹ – R³, L, m und Y die zuvor genannten Bedeutungen. X''' steht für Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl und R für C₁-C₄-Alkyl.

25

In einem ersten Schritt wird die Verbindung I.A mit einem Malonsäuredialkylester der Formel X, vorzugsweise in Gegenwart einer Base, oder mit dem Salz von X umgesetzt. Hierbei erhält man die Verbindung XI. Die Umsetzung kann in Analogie zu dem in US 5 994 360 beschriebenen Verfahren durchgeführt werden. Die Malonate X sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1585 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- Die anschließende Verseifung des Esters XI erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen [vgl. US 5 994 360]. In Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen XI vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I.C' bereits ganz oder teilweise erfolgen. Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20 °C bis 180 °C, vorzugsweise 50 °C bis 120 °C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure. Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methyl-ethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylether, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- Die nach den in den Schemata 1 bis 5 dargestellten Methoden erhaltenen Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z. B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z. T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.
- Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.
- Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im Allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Basenwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schädling erfolgen.

57

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

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

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

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

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

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid

85 84

wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

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

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

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

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

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

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

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z. B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z. B. Erdölfraktionen), Alkohole (z. B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z. B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z. B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z. B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z. B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiernmittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von

5 sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyäthylenoctylphenolether, ethoxylertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristearylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und

10 Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxylertes Rizinusöl, Polyoxyäthylenalkylether, ethoxylertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfatablaugen und Methycellulose in Betracht.

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

15 20

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

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

25 30

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

35

Beispiele für Formulierungen umfassen Produkte zur Verdünnung in Wasser, z. B.

40

87 86

- A Wasserlösliche Konzentrate (SL):**
10 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff;
5
- B Dispergierbare Konzentrate (DC):**
20 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiemittels z. B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion;
10
- C Emulgierbare Konzentrate (EC):**
15 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion;
15
- D Emulsionen (EW, EO):**
40 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion,
20
- E Suspensionen (SC, OD):**
20 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoff suspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs;
25
30
- F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG):**
50 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z. B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs;
35
- G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP):**
75 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle
40

80 87

BT

vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs;

sowie Produkte für die Direktapplikation, z. B.

5

H Stäube (DP):

5 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feintelligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel;

10

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

0,5 Gew.-Telle einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95,5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation;

15

J ULV- Lösungen (UL);

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

20

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

25

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

30

35

89 88

~~02~~

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

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

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

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

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

25

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

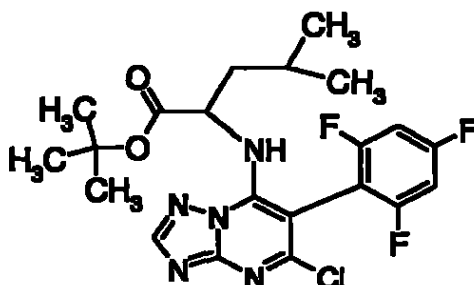
169

- Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquillon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triflorne,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
 - Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-Isopropyl
 - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
 - Schwefel
 - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthialvalcarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluzilnam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalcarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofoe-methyl, Quintozene, Zoxamid
 - Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metomnastrobin, Oryzastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
 - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
 - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1:



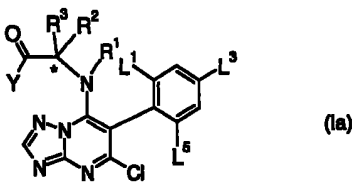
Zu einem Gemisch aus 75 mg (0,235 mmol) 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin und 44 mg (0,235 mmol) 2-Amino-4-methylpentansäure-tert.-butylester in 2 ml Dichlormethan gab man bei Raumtemperatur 32,57 µl (0,235 mmol) Triethylamin. Man rührte das Reaktionsgemisch über Nacht bei Raumtemperatur. Danach extrahierte man das Gemisch zweimal mit je 5 ml 5%iger Koch-

salzlösung. Man trennte die organische Phase ab, trocknete und engte unter vermindertem Druck ein, wobei man die Titelverbindung in einer Ausbeute > 90 % erhielt.

- 5 Nach der für Beispiel 1 angegebenen Vorschrift wurden die in den nachfolgenden Tabellen B und C angegebenen Verbindungen der allgemeinen Formeln Ia (Verbindungen I, X für Chlor und A für eine chemische Bindung stehen) und Ib (Verbindungen I, X für Chlor und A für eine Gruppe CHR⁷ stehen) hergestellt.

- 10 Alle Produkte wurden durch kombinierte HPLC/Massenspektrometrie charakterisiert. Für die HPLC wurde eine analytische RP-18 Säule (Chromolith Speed ROD der Fa. Merck KGaA, Deutschland) verwendet die bei 40°C betrieben wurde. Als Eluent diente Acetonitril mit 0,1 Vol.-% Trifluoressigsäure und 0,1 Vol.-% Trifluoressigsäure/Wasser-Gemisch (Das Verhältnis Trifluoressigsäure/Wasser wurde innerhalb 5 min von 5:95 bis 95:5 geändert). Die Massenspektrometrie wurde mittels eines Quadrupol-Massenspektrometers mit Elektrospray-Ionisation bei 80V im Positiv-Modus durchgeführt.
- 15

Tabelle B



Bsp	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ²	L ³	* 1)	min ²⁾ / m/z ³⁾
1	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	rac	4,08 / 470,10
2	H	H	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	—	3,37 / 414,00
3	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,61 / 428,00
4	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,41 / 428,00
5	H	CH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	2,96 / 388,00
6	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,56 / 428,00
7	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₃	F	F	F	S	2,46 / 501,00
8	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,54 / 462,00
9	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	S	3,86 / 456,00
10	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	2,87 / 388,00
11	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,17 / 448,00

W/O 2006/000436

PCT/E/2005/006855

92

Bsp	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁶	* 1)	min ²⁾ / m/z ²⁾
12	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	2,95 / 458,00
13	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	3,08 / 400,00
14	CH ₃	H	H	NHCH ₃	F	F	F	—	2,40 / 385,00
15	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₂ CH=CH ₂	F	F	F	S	3,74 / 454,00
16	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,62 / 515,00
17	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,69 / 476,00
18	H	CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	rac	3,60 / 428,00
19	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	rac	3,78 / 488,00
20	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	S	3,98 / 458,10
21	H	Phenyl	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,49 / 448,00
22	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,25 / 448,00
23	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₃	F	F	F	rac	3,07 / 412,00
24	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,54 / 486,00
25	H	CH ₂ -Cyclohexyl	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,84 / 488,00
26	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂	F	F	F	S	3,41 / 472,00
27	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₂ -Phenyl	F	F	F	S	3,97 / 504,10
28	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	S	3,85 / 458,00

12

Bsp	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁶	• 1)	min ² / m/z ²
29	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,51 / 458,00
30	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,61 / 441
31		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₃	F	F	H	rac	—
32	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ³⁾		F	F	F	rac	2,74 / 410
33	H	H	H	OH	F	F	F	—	2,35 / 357
34	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	3,66 / 454
35	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	3,72 / 475
36	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,90 / 455
37	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,53 / 427
38	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,22 / 469
39	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,91 / 455
40	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	R	3,78 / 441
41	H	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,14 / 399
42	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	H	Cl	S	3,38 / 411
43	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	H	Cl	S	3,53 / 425
44	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₃	F	H	Cl	S	3,61 / 425
45	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	S	3,42 / 423

Bsp	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁵	* 1)	mln ² / m/z ²⁾
46	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	S	3,57 / 437
47	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	S	3,64 / 437
48	H	CH(CH ₃)	H	OH	Cl	OCH ₃	H	S	3,42 / 423
49	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	R	3,63 / 441
50	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	R	3,81 / 455
51	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,74 / 441
52	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	R	3,33 / 413
53	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	R	3,44 / 427
54	H	C(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃	F	F	F	rac	2,95 / 428
55	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,70 / 441
56	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,53 / 424
57	H	H		CH ₂ CH ₂ O ⁵⁾	F	F	F	rac	2,64 / 382
58	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,70 / 441
59	CH ₃	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,70 / 441
60	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	R	3,61 / 427
61	H	C(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,56 / 427
62	H	CF ₃	H	H	F	F	F	rac	2,85 / 425

6

94

- 5
- 1) Konfiguration am α -Kohlenstoffatom

2) Retentionszeit in HPLC-Analytik in Minuten

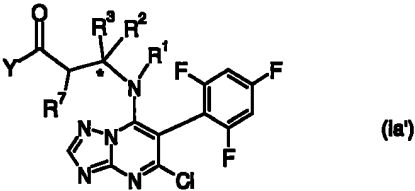
3) m/z des $[M+H]^+$ Peaks

4) Konfiguration des chiralen C-Atoms in der Seitenkette R^2

5) Heteroatom an Carbonylgruppe gebunden

Nach der für Beispiel 1 angegebenen Vorschrift wurden die in der nachfolgenden Tabelle C angegebenen Verbindungen der allgemeinen Formel Ia' hergestellt (Verbindungen I, worin L_m 2,4,6-trifluor, X für Chlor und A für eine CHR^7 -Gruppe stehen)

10 Tabelle C



Bsp	R ¹	R ⁷	R ²	R ³	Y	* 1)	min ²⁾ / m/z ³⁾
63	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	rac	3,49
64	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	–	2,79 / 386
65	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	rac	3,21 / 414

Handwritten signature

97

W/O 2006/000436

Bsp	R ¹	R ⁷	R ²	R ³	Y	* 1)	min ²⁾ / m/z ³⁾
66	H	H	H	H	OC(CH ₃) ₃	—	3,48 / 428
67	H	H	Phenyl	H	OCH ₃	rac	3,50 / 448
68	H	H	4-Isopropylphenyl	H	OCH ₃	rac	3,95 / 504
69	H	H	4-Fluorphenyl	H	OCH ₃	rac	3,45 / 480
70	H	H	4-Methylphenyl	H	OCH ₃	rac	3,60 / 476
71	H	H	2-Naphthyl	H	OCH ₃	rac	3,69 / 512

- 1) Konfiguration am α-Kohlenstoffatom
- 2) Retentionszeit in HPLC-Analytik in Minuten
- 3) m/z des [M+H]⁺ Peaks

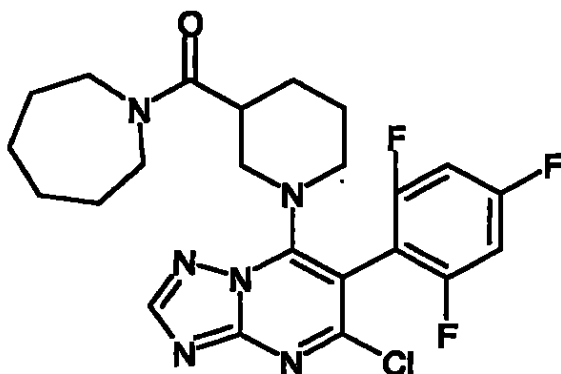
78

ICI/EP2005/006855

476

q8 q7

Beispiel 72



- 5 Retentionszeit in HPLC-Analytik in Minuten: 3,42.
m/z: 492 [M+H]⁺

Die Wirkstoffe wurden als Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Diese Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Disperglerwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zuge-
10 setzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit verursacht durch *Alternaria solani*

15 Blätter von Tomatenpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani*, in einer 2 %igen wässrigen Blomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^8$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die
20 Versuchspflanzen in einer mit Wasserdampf gesättigten Kammer bei Temperaturen von 20 bis 22 °C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Pflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell ermittelt werden konnte.

25 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe aus den Beispielen 3, 4, 37, 42, 52, 58, 13, 30, 43, 45, 46, 47 behandelten Pflanzen keinen oder nur einen geringen Befall bis maximal 15 %, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

30 Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern, verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

~~72~~

- Paprikablätter der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 bis 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Botrytis cinerea* in einer 2 %igen wässrigen Blomalzölösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^6$ Sporen/ml inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer Klimakammer bei Temperaturen zwischen 22 und 24 °C und hoher Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 5 Tagen wurde das Ausmaß des Pilzbefalls visuell anhand des Befalls der Blattfläche ermittelt.
- 10 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe aus den Beispielen 3, 4, 6, 11, 15, 25, 26, 30, 33, 35, 37, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 51, 52, 54, 55, 56, 60, 61 behandelten Pflanzen keinen oder nur einen sehr geringen Befall, d. h. unter 10 %, während die unbehandelten Pflanzen zu wenigstens 80 % befallen waren.
- 15 Anwendungsbeispiel 3 - Kurative Wirksamkeit gegen Weizenbraunrost verursacht durch *Puccinia recondita*
- Die Wirkstoffe wurden als Stammlösung aufbereitet, wobei 25 mg Wirkstoff mit einem Gemisch aus Aceton und/oder DMSO und dem Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) im Volumenverhältnis Lösungsmittel-Emulgator von 99 zu 1 bis zu einem Gesamtvolumen von 10 ml vermischt wurden und die Mischung anschließend mit Wasser bis auf 100 ml verdünnt wurde. Diese Stammlösung wurde mit dem beschriebenen Lösungsmittel-Emulgator-Wasser Gemisch zu der unten angegebenen
- 20 Wirkstoffkonzentration verdünnt.
- Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizensämlingen der Sorte "Kanzler" wurden mit einer Sporensuspension des Braunrostes (*Puccinia recondita*) inokuliert. Danach wurden die Töpfe für 24 Stunden in eine Kammer mit hoher Luftfeuchtigkeit (90 bis 95 %) und 20 bis 22 °C gestellt. Während dieser Zeit keimten die Sporen aus und die Keimschläuche drangen in das Blattgewebe ein. Die infizierten Pflanzen wurden am nächsten Tag mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Die Suspension oder Emulsion wurde wie oben beschrieben hergestellt. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen im
- 30 Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 22 °C und 65 bis 70 % relativer Luftfeuchte für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Rostpilzentwicklung auf den Blättern ermittelt.
- 35

100

99

WO 2006/000436

PCT/EP2005/006855

~~73~~

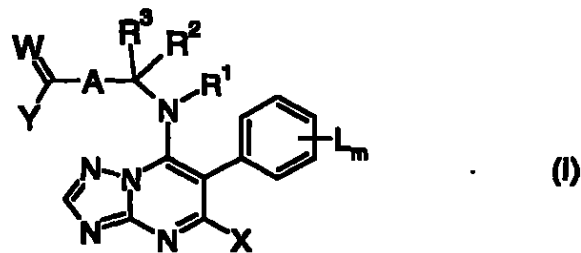
In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe aus den Beispielen 60, 61 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.



101 100

Patentansprüche

1. Substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



5

worin:

X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht;

10

W Sauerstoff oder Schwefel bedeutet;

Y für O-R⁴ oder eine Gruppe NR⁵R⁶ steht;

15

A für eine chemische Bindung oder eine Gruppe CR⁷R⁸ steht;

L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, Nitro, Amino, NHR, NR₂, Cyano, S(=O)_nA¹ oder C(=O)A² bedeutet, worin

20

R unabhängig voneinander C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl bedeutet;

A¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, NH₂, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino bedeutet;

25

n 0, 1 oder 2 bedeutet;

A² C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Halogenalkoxy, Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, NH₂, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino bedeutet;

30

m für 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5 steht;

75

- 102 107
- R¹** Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Formyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl bedeutet oder gemeinsam mit R² für C₃-C₆-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3, oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;
R^a: Halogen, OH, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;
- R²** Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, das einen Rest R^b aufweisen kann, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl oder Phenyl, das gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Reste R^c trägt, bedeutet;
R^b: OR⁹, SR¹⁰, NR¹¹R¹², COOR¹³, CONR¹⁴R¹⁵, NHC(=NR¹⁶)NR¹⁴R¹⁵, Phenyl, das gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Reste R^c trägt, 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, das 1 Stickstoffatom und gegebenenfalls 1 oder 2 weitere, unter O, S und N ausgewählte Heteroatome als Ringglieder aufweist und das gegebenenfalls 1 oder 2 Reste R^b trägt oder einen ankondensierten Phenylring aufweisen kann, der seinerseits 1 oder 2 Reste R^b aufweisen kann, oder für C₃-C₆-Cycloalkyl steht;
R^c: Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, OH, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;
- R³** Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy bedeutet oder gemeinsam mit R² für C₂-C₆-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;
- R⁴** Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl bedeutet, wobei Phenyl in den beiden letztgenannten Resten 1, 2 oder 3 der nachfolgenden Substituenten R^d aufweisen kann:
R^d: Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, C₁-C₄-Dialkylaminocarbonyl,

oder R⁴ mit einem der Reste R¹, R², R³ oder R⁷ für C₂-C₈-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 Reste, ausgewählt unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;

5

R⁵, R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl stehen oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden, sind einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus bilden, der gegebenenfalls ein weiteres, unter O, S und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweist und der gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen trägt;

10

oder einer der Reste R⁵ oder R⁶ mit einem der Reste R¹, R², R³ oder R⁷ für C₂-C₈-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 Reste, ausgewählt unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;

15

R⁷, R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy bedeuten oder einer der Reste R⁷ oder R⁸ gemeinsam mit einem der Reste R¹ oder R² für C₂-C₈-Alkylen steht, worin 1 C-Atom durch ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ersetzt sein kann und das gegebenenfalls 1, 2, 3, oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen und/oder 1 oder 2 Reste R^a tragen kann;

20

25

R⁹ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, Formyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl bedeutet;

R¹⁰ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet;

30

R¹¹, R¹² unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, stehen oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden, sind einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen Stickstoffheterocyclus bilden, der gegebenenfalls ein weiteres, unter O, S und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweist und der gegebenenfalls 1, 2, 3 oder 4 C₁-C₄-Alkylgruppen trägt, wobei einer der Reste R¹¹, R¹² auch für Formyl, C₁-C₈-Alkylcarbonyl oder C₁-C₈-Alkylthiocarbonyl stehen kann;

35

R¹³ Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Alkenyl,

40



$\text{C}_2\text{-C}_8\text{-Halogenalkenyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,
 $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-Halogencycloalkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkenyl}$, Phenyl, Phenyl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,
 wobei Phenyl in den beiden letztgenannten Resten 1, 2 oder 3 der zuvor
 genannten Substituenten R^d aufweisen kann;

5

R^{14} , R^{15} unabhängig voneinander für Wasserstoff, $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkyl}$,
 $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-Cycloalkyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$ stehen oder gemeinsam mit dem Stickstoff-
 atom, an das sie gebunden, sind einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen
 Stickstoffheterocyclen bilden, der gegebenenfalls ein weiteres, unter O, S
 und N ausgewähltes Heteroatom als Ringglied aufweist und der gegebe-
 nenfalls 1, 2, 3 oder 4 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylgruppen}$ trägt;

10

R^{16} Wasserstoff, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ oder $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$ bedeutet;

15

und die landwirtschaftlich verträglichen Salze der Verbindungen I

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Halogen bedeutet.

20

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin A eine chemische
 Bindung bedeutet.

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche, worin
 Y für eine Gruppe O-R^4 steht, worin R^4 die zuvor genannten Bedeutungen auf-
 weist.

25

5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 4, worin R^4 für $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ oder
 $\text{C}_3\text{-C}_4\text{-Alkenyl}$ steht.

30

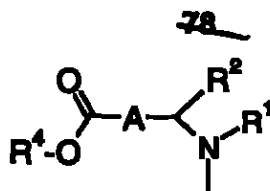
6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche, worin
 R^3 für Wasserstoff steht und R^2 für $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-Alkyl}$ oder Trifluormethyl steht oder R^1
 gemeinsam mit R^2 für $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-Alkyl}$ steht.

7. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, worin R^2 eine
 Gruppe $(\text{CH}_2)_k\text{-R}^b$ bedeutet, worin k für 1 oder 2 steht und R^b die zuvor genann-
 ten Bedeutungen aufweist.

35

8. Verbindungen der Formel I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche, worin
 R^3 für Wasserstoff steht, W Sauerstoff bedeutet und Y für eine Gruppe OR^4 steht,
 und worin die Gruppe der Formel

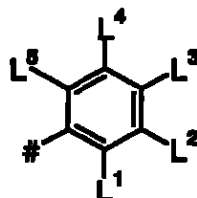
40



von einer α -Aminosäure oder einem Ester davon abgeleitet ist, wobei die α -Aminosäure ausgewählt ist unter Prolin, Pipecollinsäure, Leucin, Isoleucin, Methionin, Phenylalanin, Tyrosin und Valin.

9. Verbindungen der Formel I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche, worin m für 1, 2, 3 oder 4 steht und L ausgewählt ist unter Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl.

10. Verbindungen der Formel I, gemäß Anspruch 9, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für eine Gruppe der Formel



steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und
 L¹ Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃;
 L², L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;
 L³ Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH₃, OCH₃ oder COOCH₃; und
 L⁵ Wasserstoff, Fluor oder CH₃ bedeuten.

11. Verwendung einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen.
12. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10.
13. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, 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 10 behandelt.

106 ~~105~~

20739

COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIMIDINA Y SU USO PARA CONTROLAR HONGOS NOCIVOS

Descripción

La presente invención se refiere a nuevos compuestos de triazolopirimidina y a su uso en el control de hongos dañinos y también a compuestos para la protección de cultivos, que comprende dichos compuestos como ingredientes activos.

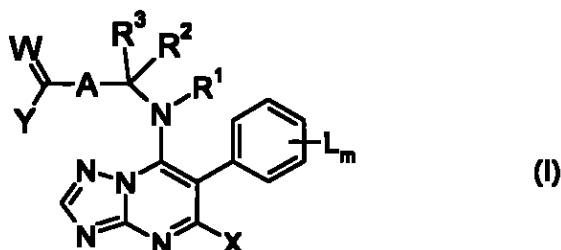
Los documentos EP-A 71792, US 5.994.360, EP-A 550113, WO-A 94/20501, EP-A 834.513, WO-A 98/46608 y WO 03/080615 describen triazolo[1,5a]pirimidinas con actividad fungicida que lleva un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición 6 del anillo azolopirimidina y NH_2 o un grupo amino primario o secundario en la posición 7.

Respecto de su acción fungicida, algunas de las triazolopirimidinas conocidas del arte previo y con un grupo amino en la posición 7 no son totalmente satisfactorias, o tienen propiedades indeseadas, tales como escasa compatibilidad con plantas útiles.

En consecuencia, es un objeto de la presente invención proporcionar compuestos nuevos con mayor actividad fungicida y/o mayor compatibilidad con plantas útiles.

Sorprendentemente, este objeto se logra mediante compuestos triazolopirimidinas de la fórmula I

A



en donde:

X es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_2 ;

W es oxígeno o azufre;

Y es $O-R^4$ o un grupo NR^5R^6 ;

A es un enlace químico o un grupo CR^7R^8 ;

los radicales **L** independientemente uno de otro son halógeno, C_1-C_6 -alquilo, alquenilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , nitro, amino, NHR , NR^2 , ciano, $S(=O)_nA^1$ o $C(=O)A^2$, en donde

R independientemente uno de otro es alquilo C_1-C_8 o alquilcarbonilo C_1-C_8 ;

A¹ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C_1-C_8 , NH_2 , alquilamino C_1-C_8 o di(alquil C_1-C_8)amino;

n es 0, 1 ó 2;

A² es alquenilo C_0-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , haloalcoxi C_1-C_6 , hidrógeno, hidroxilo, alquilo C_1-C_8 , NH_2 , alquilamino C_1-C_8 o di(alquil C_1-C_8)amino;

m es 0 ó 1, 2, 3, 4 ó 5;

R¹ es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , formilo, alquilcarbonilo C_1-C_4 o alcoxycarbonilo C_1-C_4 o junto con R^2 es alquilenio C_3-C_6 donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos

alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a ;

R^a : es halógeno, OH, alcoxi C_1-C_4 -o alcoxycarbonilo C_1-C_4 ;

R^2 es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 que pueden tener un radical R^b , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 o fenilo que opcionalmente lleva 1, 2 ó 3 radicales R^c ;

R^b : es OR^9 , SR^{10} , $NR^{11}R^{12}$, $COOR^{13}$, $CONR^{14}R^{15}$, $NHC(=NR^{16})NR^{14}R^{15}$, fenilo que opcionalmente lleva 1, 2 ó 3 radicales R^c , heteroarilo de 5 ó 6 miembros que tiene 1 átomo de nitrógeno y opcionalmente 1 ó 2 otros heteroátomos seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembros del anillo y que opcionalmente lleva 1 ó 2 radicales R^b o lleva un anillo fusionado que por su parte puede tener 1 ó 2 radicales R^b , o es cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^c : es halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , OH, alcoxi C_1-C_4 o alcoxycarbonilo C_1-C_4 ;

R^3 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 o junto con R^2 es alquilenilo C_2-C_6 , en donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a .

R^4 es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , hidroxialcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_6 , alquilenilo C_2-C_6 , haloalquilenilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilenilo C_3-C_6 , fenilo, fenilalquilo C_1-C_4 , en donde fenilo en los dos últimos mencionados radicales puede tener 1, 2 ó 3 de los sustituyentes R^d siguientes:

R^d : es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfinilo C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_1-C_4 , alquilcarboniloxi C_1-C_4 , alquilaminocarbonilo C_1-C_4 , dialquilaminocarbonilo C_1-C_4 , o R^4 junto con uno de los radicales R^1 , R^2 , R^3 o R^7 es alquilenos C_2-C_6 , en donde un átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a ;

R^5 , R^6 independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado de nitrógeno de 5, 6 ó 7 miembros que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C_1-C_4 ;

o uno de radicales R^5 o R^6 junto con uno de los radicales R^1 , R^2 , R^3 o R^7 es alquilenos C_2-C_6 , en donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 radicales seleccionado del grupo que consiste en halógeno y alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a ;

R^7 , R^8 independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 o uno de los radicales R^7 o R^8 junto con uno de los radicales R^1 o R^2 es alquilenos C_2-C_6 , en donde 1 átomo de carbono

se puede reemplazar por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a ;

R^9 es hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , formilo o alquilcarbonilo C_1-C_8 ;

R^{10} es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^{11} , R^{12} independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado de nitrógeno de 5, 6 ó 7 miembros que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C_1-C_4 , en donde uno de los radicales R^{11} , R^{12} también puede ser formilo, alquilcarbonilo C_1-C_8 o alquiltiocarbonilo C_1-C_8 ;

R^{13} es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , hidroxialcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , haloalquenilo C_2-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_8 , fenilo, fenilalquilo C_1-C_4 , en donde el fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede tener 1, 2 ó 3 de los sustituyentes R^d anteriores;

R^{14} , R^{15} independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , o junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo saturado de nitrógeno de 5, 6 ó 7 miembros que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4

grupos alquilo C_1-C_4 ;

R^{16} es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

y por las sales de los compuestos I aceptables en agricultura.

La presente invención en consecuencia provee los compuestos triazolopirimidina de la fórmula I y sus sales aceptables en agricultura.

La presente invención también provee el uso de los compuestos triazolopirimidina de la fórmula I, sus tautómeros y sus sales aceptables en agricultura para el control de hongos fitopatógenos (= hongos dañinos), y también un método para controlar hongos fitopatógenos, en donde dicho método comprende tratar los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas que se desea proteger contra el ataque de hongos, con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I, un tautómero de I y/o con una sal de aceptación en agricultura de I o uno de sus tautómeros.

La presente invención provee composiciones para controlar hongos dañinos, en donde las composiciones comprenden al menos un compuesto de la fórmula I, un tautómero de I y/o una de sus sales aceptables en agricultura o uno de sus tautómeros y al menos un portador líquido o sólido. Según el patrón de sustitución, los compuestos de la fórmula I y sus tautómeros pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso se presentan como enantiómeros puros o diastereómeros puros o como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La invención provee enantiómeros o diastereómeros puros y también sus mezclas.

Las sales útiles adecuadas desde un punto de vista agrícola son especialmente las sales de los cationes o las sales ácidas de adición de los ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efectos adversos sobre la acción fungicida de los compuestos I. En consecuencia,

11/12

los cationes adecuados son en particular los cationes de metales alcalinos, de preferencia sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, de preferencia calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, de preferencia manganeso, cobre, zinc y hierro, y también el ion amonio que si se desea puede portar uno a cuatro sustituyentes alquilo C_1-C_4 y/o un sustituyente fenilo o bencilo, de preferencia diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutylamonio, trimetilbencilamonio, también iones fosfonio, iones sulfonio, de preferencia tri(alquil C_1-C_4)sulfonio, e iones sulfoxonio, de preferencia tri(alquil C_1-C_4)sulfoxonio.

Los aniones de sales ácidas de adición son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, fosfato de dihidrógeno, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, carbonato de hidrógeno, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y también los aniones de ácido alcanoico C_1-C_4 , de preferencia formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar al hacer reaccionar I con un ácido del anión correspondiente, de preferencia de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

En las definiciones de las variables dadas en las fórmulas anteriores se usan términos colectivos que generalmente son representativos de los sustituyentes en cuestión. El término C_n-C_m denota la cantidad de átomos de carbono posibles en cada caso en el sustituyente o el residuo del sustituyente:

halógeno: flúor, cloro, bromo y yodo;

alquilo y todos los residuos alquilo en alcoxi, alquiltio, alcoxialquilo, alcoxialcoxi, alquilamino y dialquilamino: radicales hidrocarbonatos saturados de cadenas lineales o ramificadas con 1 a 4, a 6, a 8 o a 10 átomos de carbono, por ejemplo alquilo C_1-C_6 , tal como metilo, etilo,

—7—

propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 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;

haloalquilo: grupos alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 4 o a 6 átomos de carbono (como se mencionó antes), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno de estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó antes, por ejemplo haloalquilo C_1-C_2 , tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

alquenilo: radicales hidrocarbonatos monoinsaturados de cadena lineal o ramificada con 2 a 4, a 6, a 8 o a 10 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo alquenilo C_2-C_6 , tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metilenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-

43
774

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

alcadienilo: radicales hidrocarbonatos diinsaturados de cadena lineal o ramificada con 4 a 10 átomos de carbono y dos dobles enlaces en cualquier posición, por ejemplo 1,3-butadienilo, 1-metil-1,3-butadienilo, 2-metil-1,3-butadienilo, penta-1,3-dien-1-ilo, hexa-1,4-dien-1-ilo, hexa-1,4-dien-3-ilo, hexa-1,4-dien-6-ilo, hexa-1,5-dien-1-ilo, hexa-1,5-dien-3-ilo, hexa-1,5-dien-4-ilo, hepta-1,4-dien-1-ilo, hepta-1,4-dien-3-ilo, hepta-1,4-dien-6-ilo, hepta-1,4-dien-7-ilo, hepta-1,5-dien-1-ilo, hepta-1,5-dien-3-ilo, hepta-1,5-dien-4-ilo, hepta-1,5-dien-7-ilo, hepta-1,6-dien-1-ilo, hepta-1,6-dien-3-ilo, hepta-1,6-dien-4-ilo, hepta-1,6-dien-5-ilo, hepta-1,6-dien-2-ilo, octa-1,4-dien-1-ilo, octa-1,4-dien-2-ilo, octa-1,4-dien-3-ilo, octa-

1,4-dien-6-ilo, octa-1,4-dien-7-ilo, octa-1,5-dien-1-ilo, octa-1,5-dien-3-ilo, octa-1,5-dien-4-ilo, octa-1,5-dien-7-ilo, octa-1,6-dien-1-ilo, octa-1,6-dien-3-ilo, octa-1,6-dien-4-ilo, octa-1,6-dien-5-ilo, octa-1,6-dien-2-ilo, deca-1,4-dienilo, deca-1,5-dienilo, deca-1,6-dienilo, deca-1,7-dienilo, deca-1,8-dienilo, deca-2,5-dienilo, deca-2,6-dienilo, deca-2,7-dienilo, deca-2,8-dienilo y similares;

alquinilo: grupos hidrocarbonatos de cadena lineal o ramificada con 2 a 4, 2 a 6, 2 a 8 o 2 a 10 átomos de carbono y un triple enlace en cualquier posición, por ejemplo alquinilo C_7-C_6 , tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

cicloalquilo: grupos hidrocarbonados monocíclicos saturados con 3 a 8, de preferencia a 6, miembros en el anillo carbonado, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

cicloalquenilo: grupos hidrocarbonados monocíclicos monoinsaturados con 3 a 8, de preferencia a 6, miembros en el anillo carbonado, tales como ciclopenten-1-ilo, ciclopenten-3-ilo, ciclohexen-1-ilo, ciclohexen-3-ilo y ciclohexen-4-ilo;

bicicloalquilo: un radical hidrocarbonato bicíclico con 5 a 10 átomos de carbono, tal como biciclo[2.2.1]hept-1-ilo, biciclo[2.2.1]hept-2-ilo, biciclo[2.2.1]hept-7-ilo, biciclo[2.2.2]oct-1-ilo, Biciclo[2.2.2]oct-2-ilo, biciclo[3.3.0]octilo y biciclo[4.4.0]decilo;

alquilamino: un grupo alquilo grupo adosado a través de un grupo NH, en donde alquilo es uno de los radicales alquilo antes mencionados, en general con 1 a 6 y en particular 1 a 4 átomos de carbono, tales como metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino, n-butilamino y similares;

dialquilamino: un radical de la fórmula N(alquilo)₂, en donde alquilo es uno de los radicales alquilo antes mencionados, en general con 1 a 6 y en particular 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo dimetilamino, dietilamino, metiletilamino, N-metil-N-propilamino y similares;

alcoxi C₁-C₄: un grupo alquilo, adosado a través de oxígeno, con 1 a 4 átomos de carbono: por ejemplo metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi o 1,1-dimetiletoxi;

alcoxi C₁-C₆: alcoxi C₁-C₄ como se mencionó antes, y también, por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi o 1-etil-2-metilpropoxi;

haloalcoxi C₁-C₄: un radical alcoxi C₁-C₄ como se mencionó antes, que está parcialmente o total mente sustituido con flúor, cloro, bromo y/o yodo, de preferencia con flúor, es decir, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂,

OCF₃, OCH₂Cl OCHCl₂, OCCl₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, OC₂F₅, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetoxi, 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi;

haloalcoxi C₁-C₆: haloalcoxi C₁-C₄ como se mencionó antes, y también, por ejemplo, 5-fluoropentoxi, 5-cloropentoxi, 5-bromopentoxi, 5-yodopentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluorohexoxi, 6-clorohexoxi, 6-bromohexoxi, 6-yodohexoxi o dodecafluorohexoxi;

alqueniloxi: alquenilo como se mencionó antes, adosado a través de un átomo de oxígeno, por ejemplo alqueniloxi C₂-C₆, tal como viniloxi, 1-propeniloxi, 2-propeniloxi, 1-metileteniloxi, 1-buteniloxi, 2-buteniloxi, 3-buteniloxi, 1-metil-1-propeniloxi, 2-metil-1-propeniloxi, 1-metil-2-propeniloxi, 2-metil-2-propeniloxi, 1-penteniloxi, 2-penteniloxi, 3-penteniloxi, 4-penteniloxi, 1-metil-1-buteniloxi, 2-metil-1-buteniloxi, 3-metil-1-buteniloxi, 1-metil-2-buteniloxi, 2-metil-2-buteniloxi, 3-metil-2-buteniloxi, 1-metil-3-buteniloxi, 2-metil-3-buteniloxi, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propeniloxi, 1,2-dimetil-1-propeniloxi, 1,2-dimetil-2-propeniloxi, 1-etil-1-propeniloxi, 1-etil-2-propeniloxi, 1-hexeniloxi, 2-hexeniloxi, 3-hexeniloxi, 4-hexeniloxi, 5-hexeniloxi, 1-metil-1-penteniloxi, 2-metil-1-penteniloxi, 3-metil-1-penteniloxi,

4-metil-1-penteniloxi, 1-metil-2-penteniloxi, 2-metil-2-penteniloxi, 3-metil-2-penteniloxi, 4-metil-2-penteniloxi, 1-metil-3-penteniloxi, 2-metil-3-penteniloxi, 3-metil-3-penteniloxi, 4-metil-3-penteniloxi, 1-metil-4-penteniloxi, 2-metil-4-penteniloxi, 3-metil-4-penteniloxi, 4-metil-4-penteniloxi, 1,1-dimetil-2-buteniloxi, 1,1-dimetil-3-buteniloxi, 1,2-dimetil-1-buteniloxi, 1,2-dimetil-2-buteniloxi, 1,2-dimetil-3-buteniloxi, 1,3-dimetil-1-buteniloxi, 1,3-dimetil-2-buteniloxi, 1,3-dimetil-3-buteniloxi, 2,2-dimetil-3-buteniloxi, 2,3-dimetil-1-buteniloxi, 2,3-dimetil-2-buteniloxi, 2,3-dimetil-3-buteniloxi, 3,3-dimetil-1-buteniloxi, 3,3-dimetil-2-buteniloxi, 1-etil-1-buteniloxi, 1-etil-2-buteniloxi, 1-etil-3-buteniloxi, 2-etil-1-buteniloxi, 2-etil-2-buteniloxi, 2-etil-3-buteniloxi, 1,1,2-trimetil-2-propeniloxi, 1-etil-1-metil-2-propeniloxi, 1-etil-2-metil-1-propeniloxi y 1-etil-2-metil-2-propeniloxi;

alquiniloxi: alquinilo como se mencionó antes, adosado a través de un átomo de oxígeno, por ejemplo alquiniloxi C_3-C_6 , tal como 2-propiniloxi, 2-butiniloxi, 3-butiniloxi, 1-metil-2-propiniloxi, 2-pentiniloxi, 3-pentiniloxi, 4-pentiniloxi, 1-metil-2-butiniloxi, 1-metil-3-butiniloxi, 2-metil-3-butiniloxi, 1-etil-2-propiniloxi, 2-hexiniloxi, 3-hexiniloxi, 4-hexiniloxi, 5-hexiniloxi, 1-metil-2-pentiniloxi, 1-metil-3-pentiniloxi y similares;

alquilleno: una cadena hidrocarbonada saturada lineal con 2 a 6 y en particular 2 a 4 átomos de carbono, tal como etano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo, butano-1,4-diilo, pentano-1,5-diilo o hexano-1,6-diilo;

un heterociclo de cinco o seis miembros saturado o parcialmente insaturado que contiene uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre como miembros

del anillo: por ejemplo heterociclos mono y bicíclicos (heterociclilo) que contienen, además de los miembros del anillo de carbono, uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre, o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, por ejemplo 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 1-pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo,

2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 1-piperidinilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 4-morfolinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo y también los correspondientes radicales -ilideno;

un heterociclo de siete miembros saturado o parcialmente insaturado que contiene uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre como miembros del anillo: por ejemplo heterociclos mono y bicíclicos con anillos de 7 miembros que contienen, además de los miembros del anillo carbonado, uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, por ejemplo tetra- y hexahidroazepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, hexahidroazepin-1-, -2-, -3- o -4-ilo, tetra- y hexahidrooxepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, hexahidroazepin-1-, -2-, -3- o -4-ilo, tetra- y hexahidro-1,3-diazepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-diazepinilo, tetra- y hexahidro-1,3-oxazepinilo, tetra- y

hexahidro-1,4-oxazepinilo, tetra- y hexahidro-1,3-dioxepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-dioxepinilo y los correspondientes radicales -ilideno; un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene uno, dos tres o cuatro heteroátomos del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre: heteroarilo mono o bicíclico, por ejemplo heteroarilo de cinco miembros unido a través de un carbono y que contiene uno a tres átomos de nitrógeno o uno o dos átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros del anillo, tal como 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo; heteroarilo de 5 miembros que se adosa a través de nitrógeno y contiene uno a tres átomos de nitrógeno como miembros del anillo, tales como pirrol-1-ilo, pirazol-1-ilo, imidazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo y 1,2,4-triazol-1-ilo; heteroarilo de 6 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno como miembros del anillo, tales como piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo.

Desde el punto de vista del uso de los fungicidas, se prefieren los compuestos de la fórmula I, en donde las variables y X, A, W, R¹, R², R³, m y L independientemente entre sí y en particular en combinación son como se define a continuación.

121
122

X es halógeno, especialmente cloro, o alquilo C_1-C_4 , especialmente metilo, con particular preferencia halógeno y con muy particular preferencia cloro;

A es un enlace químico o CH_2 , en particular un enlace químico;

W es oxígeno;

R¹ es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , o **R¹** junto con **R²** forma un grupo alquileo C_2-C_6 lineal o ramificado, en particular un grupo alquileo C_3-C_4 ;

R² es alquilo C_2-C_6 , trifluorometilo o un grupo $(CH_2)_k-R^b$, en donde **k** es 1 ó 2 y **R^b** es como se definió antes;

R³ es hidrógeno;

m es 1, 2, 3 ó 4, en particular 1, 2 ó 3;

L es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o

alcoxycarbonilo C_1-C_6 , en particular flúor, bromo, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o alcoxycarbonilo C_1-C_4 , de preferencia particular flúor, cloro, alquilo C_1-C_2 , tal como metilo o etilo, fluoroalquilo C_1-C_2 , tal como trifluorometilo, alcoxi C_1-C_2 , tal como metoxi, o alcoxycarbonilo C_1-C_2 , tal como metoxycarbonilo. Además, se da preferencia a los compuestos I, en donde al menos un grupo **L** se ubica en la posición orto respecto del punto de fijación al esqueleto de triazolopirimidina.

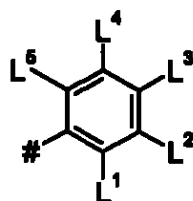
En una forma de realización de preferencia, **Y** es un grupo $O-R^4$, en donde **R⁴** es como se definió antes. Aquí, **R⁴** es en particular alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 alquilo C_1-C_2 o alquileo C_3-C_4 y en particular H, metilo, etilo, n-propilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo o 2-propenilo (= alilo). En una forma de realización de mayor preferencia, **Y** es un grupo

122
123

$O-R^4$, en donde R^4 , junto con el radical R^2 , es un grupo alquileo C_2-C_4 .

En otra forma de realización de preferencia, Y es un grupo $N-R^5R^6$, en donde R^5 , R^6 son como se definió antes. Aquí, R^5 es en particular H, alquilo C_1-C_4 o alqueno C_3-C_4 y en particular metilo, etilo, n-propilo o n-propenilo. R^6 es en particular H, alquilo C_1-C_4 o alqueno C_3-C_4 y en particular H, metilo, etilo o n-propilo. R^5 y R^6 junto con el átomo de nitrógeno al que están adosados también pueden formar un heterociclo de nitrógeno saturado de 5 a 7 miembros, que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1 a 4 grupos metilo: aquí Y es 1-pirrolidinilo, 1-piperidinilo, 4-morfolinilo, 4-tiomorfolinilo o 4-metilpiperazin-1-il. En una forma de realización de especial preferencia, Y es un grupo $N-R^5R^6$, en donde R^5 , junto con el radical R^2 , es un grupo alquileo C_2-C_4 y R^6 es hidrógeno.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da particular preferencia a aquellos, en donde el grupo fenilo sustituido con L_m es el grupo de la fórmula



en donde # es el punto de unión al esqueleto de triazolopirimidina y

L^1 es flúor, cloro, CH_3 o CF_3 ;

L^2 , L^4 independientemente uno de otro son hidrógeno, cloro o flúor, en donde L^4 también puede ser NO_2 ;

L^3 es hidrógeno, flúor, cloro, ciano, NO_2 , alquilo C_1-C_4 ,

123
124

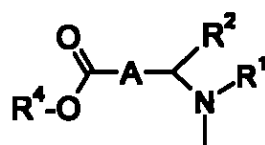
especialmente CH₃, alcoxi C₁-C₄, en especial OCH₃, o CO(A²), en donde A² es OH, alcoxi C₁-C₄, en especial OCH₃, NH₂, alquilamino C₁-C₄; y

L³ es hidrógeno, flúor, cloro o alquilo C₁-C₄, en especial CH₃.

Entre los compuestos I se da particular preferencia a aquellos, en donde R¹ es hidrógeno o R¹ junto con R² forma un grupo lineal o ramificado alquileo C₂-C₆, en particular un grupo alquileo C₃-C₅ lineal. Aquí, R³ es en particular hidrógeno.

También se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula I, en donde R² es alquilo C₂-C₆. Aquí, R³ es en particular hidrógeno. En este caso, de modo similar, R¹ es en particular hidrógeno.

Entre ellos, se da preferencia a los compuestos de la fórmula I, en donde R³ es hidrógeno, W es oxígeno e Y es un grupo OR⁴ con los significados aquí mencionados y en particular los significados preferidos, y los radicales R¹ y R² corresponden a los de los siguientes aminoácidos: prolina, ácido pipercolínico, leucina, isoleucina, metionina, fenilalanina, tirosina y valina. En otras palabras, el grupo de la fórmula



deriva de uno de los α-aminoácidos antes mencionados o un éster, en particular un éster alquilo C₁-C₄ un éster alquenoilo C₃-C₄.

Otra forma de realización de preferencia de la invención se refiere a compuestos I, en donde R² es un grupo (CH₂)_k-R^b, en donde k es 1 ó 2 y R^b es como se definió antes. Aquí, R³ es en particular hidrógeno. En este caso, de modo similar, R¹ es en particular hidrógeno. Aquí, R^b tiene

1221
125.

en particular los siguientes significados: fenilo, 4-hidroxifenilo, 3,4-dihidroxifenilo, imidazol-4-ilo, indol-3-ilo, 5-hidroindol-3-ilo, alquiltio C_1-C_4 , en especial $S-CH_3$, alcoxi C_1-C_4 o alcóxicarbonilo C_1-C_4 .

Si Y en la fórmula I es un grupo NR^5R^6 , R^5 y R^6 independientemente uno de otro tienen los siguientes significados: H o alquilo C_1-C_4 .

En los grupos OR^9 , SR^{10} , $NR^{11}R^{12}$, $C(O)OR^{13}$, $CONR^{14}R^{15}$ y $C(=N-R^{16})NR^{14}R^{15}$, $NHC(W)R^{16}$, $C(W)R^{17}$ y $NR^{18}R^{19}$, las variables tienen en particular los siguientes significados:

R^9 es en particular H, alquilo C_1-C_4 , $C(O)H$ o alquilcarbonilo C_1-C_4 ;

R^{10} es en particular H o alquilo C_1-C_4 ;

R^{11} y R^{12} es en particular H, alquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_4 o alquil(tiocarbonilo) C_1-C_4 . $NR^{11}R^{12}$ es en particular NH_2 , $NHCH_3$, NHC_2H_5 , $N(CH_3)_2$, $N(C_2H_5)CH_3$, $NHC(O)CH_3$ o $NHC(O)H$.

R^{13} es en particular alquilo C_1-C_4 .

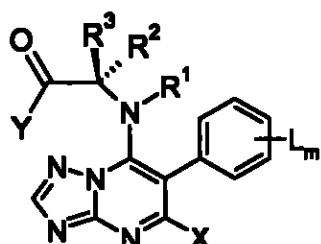
R^{14} es en particular H o alquilo C_1-C_4 .

R^{15} es en particular H o alquilo C_1-C_4 .

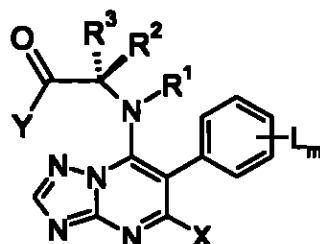
R^{16} es en particular H o alquilo C_1-C_4 .

Entre los ejemplos de compuestos de preferencia de la fórmula I de acuerdo con la invención son los enantiómeros, listados en las tablas 1 a 60 siguientes, de las fórmulas I-L y I-D, y también los racematos de la fórmula I-R, en donde los variables R^1 , R^2 , R^3 e Y en cada caso tienen juntos el significado dado en una de las hileras 1 a 814 de la tabla A:

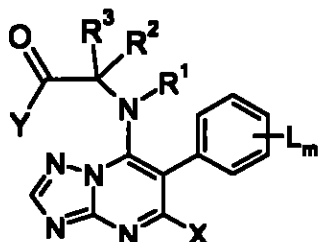
125
126



(I-L)



(I-D)



(I-R)

Tabla 1

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-fluoro-6-cloro y la combinación de Y, R¹, R² y R³ para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 2

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-difluoro y la combinación de Y, R¹, R² y R³ para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 3

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-dicloro y la combinación de Y, R¹, R² y R³ para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 4

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-fluoro-6-metilo y la combinación de Y, R¹, R² y R³ para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

226
127

Tabla 5

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,4,6-trifluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 6

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxi y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 7

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es pentafluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 8

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-metil-4-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 9

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-trifluorometilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 10

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-metoxi-6-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 11

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto

SDT
128

corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 12

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 13

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,4-difluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 14

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-fluoro-4-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 15

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-cloro-4-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 16

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,3-difluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A

Tabla 17

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,5-difluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 18

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro,

L_m , es 2,3,4-trifluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 19

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m , es 2-metilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 20

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,4-dimetilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 21

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-metil-4-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 22

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-fluoro-4-metilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 23

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-dimetilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 24

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,4,6-trimetilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 25

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-ciano y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 26

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 27

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 28

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-4-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 29

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-5-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 30

Compuestos de las fórmulas I-D, I-L y I-R, en donde X es cloro, L_m es 2-trifluorometil-5-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 31

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-fluoro-6-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un

compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 32

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-difluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 33

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-dicloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 34

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-fluoro-6-metilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 35

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,4,6-trifluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 36

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxi y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 37

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es pentafluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 38

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo,

131

132

L_m es 2-metil-4-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 39

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-trifluorometilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 40

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-metoxi-6-fluoro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 41

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-cloro y combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 42

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-flúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 43

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,4-diflúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 44

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-fluoro-4-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 43

132
133

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-cloro-4-flúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 46

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,3-diflúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 47

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,5-diflúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 48

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,3,4-triflúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 49

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-metilo la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 50

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,4-dimetilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 51

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-metil-4-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 52

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-fluoro-4-metilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 53

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-dimetilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 54

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,4,6-trimetilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 55

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-difluoro-4-ciano y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 56

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-difluoro-4-metilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 57

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2,6-difluoro-4-metoxycarbonilo y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 58

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo,

134
135

L_m es 2-trifluorometil-4-flúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 59

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-trifluorometil-5-flúor y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla 60

Compuestos de las fórmulas I-L, I-D y I-R, en donde X es metilo, L_m es 2-trifluorometil-5-cloro y la combinación de Y, R^1 , R^2 y R^3 para un compuesto corresponde en cada caso a una hilera de la tabla A.

Tabla A:

Nº	R^1	R^2	R^3	Y
1	H	H	H	OH
2	H	Fenilo	H	OH
3	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OH
4	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OH
5	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OH
6	H	CH ₂ -Fenilo	H	OH
7	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OH
8	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OH
9	H	CH ₃	H	OH
10	H	CH(CH ₃) ₂	H	OH
11	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OH
12	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OH
13	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OH
14	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OH
15	H	CH ₂ -SH	H	OH
16	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OH
17	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OH
18	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OH
19	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OH
20	H	CH ₂ -CO-OH	H	OH
21	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OH
22	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OH
23	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OH

138
136

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
24	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OH
25	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OH
26	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OH
27	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OH
28	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OH
29	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OH
30	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OH
31	H	CH ₂ -OH	H	OH
32	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OH
33	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OH
34	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OH
35	H	CHCH ₃ -OH	H	OH
36	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OH
37	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OH
38	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OH
39		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OH
40		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OH
41		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OH
42	H	CH ₂ CH ₂		OH
43	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OH
44	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OH
45	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OH
46	H	H	H	OCH ₃
47	H	Fenilo	H	OCH ₃
48	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₃
49	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₃
50	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₃
51	H	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₃
52	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₃
53	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₃
54	H	CH ₃	H	OCH ₃
55	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
56	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
57	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
58	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
59	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
60	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₃
61	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₃
62	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃

136
137

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
63	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃
64	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
65	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
66	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
67	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
68	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
69	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
70	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
71	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
72	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
73	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
74	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
75	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
76	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₃
77	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₃
78	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
79	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
80	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₃
81	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₃
82	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
83	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
84		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₃
85		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₃
86		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₃
87	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₃
88	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
89	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
90	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
91	H	H	H	OCH ₂ CH ₃
92	H	Fenilo	H	OCH ₂ CH ₃
93	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH ₃
94	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₂ CH ₃
95	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₂ CH ₃
96	H	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₂ CH ₃
97	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₂ CH ₃
98	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₂ CH ₃
99	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
100	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
101	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃

137
138

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
102	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
103	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
104	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
105	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
106	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
107	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
108	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
109	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
110	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
111	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
112	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
113	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
114	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
115	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
116	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
117	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
118	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
119	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
120	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
121	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
122	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
123	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
124	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
125	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
126	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
127	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
128	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
129		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
130		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
131		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
132	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
133	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
134	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
135	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
136	H	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
137	H	Fenilo	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
138	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
139	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
140	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃

138

139

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
141	H	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
142	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
143	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
144	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
145	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
146	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
147	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
148	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
149	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
150	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
151	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
152	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
153	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
154	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
155	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
156	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
157	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
158	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
159	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
160	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
161	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
162	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
163	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
164	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
165	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
166	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
167	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
168	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
169	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
170	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
171	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
172	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
173	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
174		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
175		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
176		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
177	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
178	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
179	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃

139
140

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
180	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ CH ₃
181	H	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
182	H	Fenilo	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
183	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
184	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
185	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
186	H	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
187	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
188	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
189	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
190	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
191	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
192	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
193	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
194	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
195	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
196	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
197	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
198	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
199	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
200	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
201	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
202	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
203	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
204	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
205	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
206	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
207	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
208	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
209	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
210	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
211	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
212	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
213	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
214	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
215	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
216	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
217	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
218	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃

141

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
219		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
220		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
221		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
222	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
223	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
224	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
225	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
226	H	H	H	OC(CH ₃) ₃
227	H	Fenilo	H	OC(CH ₃) ₃
228	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OC(CH ₃) ₃
229	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OC(CH ₃) ₃
230	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OC(CH ₃) ₃
231	H	CH ₂ -Fenilo	H	OC(CH ₃) ₃
232	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OC(CH ₃) ₃
233	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OC(CH ₃) ₃
234	H	CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
235	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
236	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
237	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
238	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
239	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
240	H	CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
241	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
242	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
243	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
244	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
245	H	CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
246	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
247	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
248	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
249	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
250	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
251	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
252	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
253	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
254	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
255	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
256	H	CH ₂ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
257	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃

142

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
258	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
259	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
260	H	CHCH ₃ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
261	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
262	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
263	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
264		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
265		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
266		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
267	H	CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
268	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
269	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
270	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
271	H	H	H	OCH(CH ₃) ₂
272	H	Fenilo	H	OCH(CH ₃) ₂
273	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH(CH ₃) ₂
274	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH(CH ₃) ₂
275	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH(CH ₃) ₂
276	H	CH ₂ -Fenilo	H	OCH(CH ₃) ₂
277	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH(CH ₃) ₂
278	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH(CH ₃) ₂
279	H	CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
280	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
281	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
282	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
283	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
284	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
285	H	CH ₂ -SH	H	OCH(CH ₃) ₂
286	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH(CH ₃) ₂
287	H	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
288	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
289	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
290	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH(CH ₃) ₂
291	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
292	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH(CH ₃) ₂
293	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
294	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
295	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
296	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH(CH ₃) ₂

142
143

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
297	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
298	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH(CH ₃) ₂
299	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
300	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
301	H	CH ₂ -OH	H	OCH(CH ₃) ₂
302	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
303	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
304	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
305	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH(CH ₃) ₂
306	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
307	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
308	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂
309		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
310		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
311		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH(CH ₃) ₂
312	H	CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
313	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
314	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
315	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH(CH ₃) ₂
316	H	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
317	H	Fenilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
318	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
319	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
320	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
321	H	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
322	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
323	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
324	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
325	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
326	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
327	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
328	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
329	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
330	H	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
331	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
332	H	CH ₂ -SCH ₃		OCH ₂ CH=CH ₂
333	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
334	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
335	H	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂

443
744

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
336	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
337	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
338	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
339	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
340	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
341	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
342	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
343	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
344	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
345	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
346	H	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
347	H	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
348	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
349	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
350	H	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
351	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
352	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
353	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
354		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
355		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
356		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
357	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
358	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
359	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
360	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
361	H	H	H	NHCH ₃
362	H	Fenilo	H	NHCH ₃
363	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	NHCH ₃
364	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	NHCH ₃
365	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	NHCH ₃
366	H	CH ₂ -Fenilo	H	NHCH ₃
367	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	NHCH ₃
368	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	NHCH ₃
369	H	CH ₃	H	NHCH ₃
370	H	CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
371	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
372	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
373	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
374	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃

144
145

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
375	H	CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
376	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
377	H	CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
378	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
379	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
380	H	CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
381	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
382	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
383	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
384	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
385	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
386	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
387	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
388	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
389	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
390	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
391	H	CH ₂ -OH	H	NHCH ₃
392	H	CH ₂ -OCH ₃	H	NHCH ₃
393	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
394	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
395	H	CHCH ₃ -OH	H	NHCH ₃
396	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	NHCH ₃
397	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
398	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
399		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	NHCH ₃
400		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	NHCH ₃
401		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	NHCH ₃
402	H	CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
403	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
404	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
405	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
406	CH ₃	H	H	OCH ₃
407	CH ₃	Fenilo	H	OCH ₃
408	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₃
409	CH ₃	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₃
410	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₃
411	CH ₃	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₃
412	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₃
413	CH ₃	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₃

148
746

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
414	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
415	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
416	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
417	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
418	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
419	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃
420	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OCH ₃
421	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₃
422	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃
423	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃
424	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
425	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
426	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
427	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
428	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
429	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
430	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₃
431	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₃
432	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃
433	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃
434	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
435	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
436	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OCH ₃
437	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₃
438	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
439	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
440	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₃
441	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₃
442	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
443	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃
444	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OCH ₃
445	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
446	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
447	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₃
448	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
449	CH ₃	Fenilo	H	OCH ₂ CH ₃
450	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH ₃
451	CH ₃	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₂ CH ₃
452	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₂ CH ₃

18/747

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
453	CH ₃	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₂ CH ₃
454	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₂ CH ₃
455	CH ₃	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₂ CH ₃
456	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
457	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
458	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
459	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
460	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
461	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
462	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
463	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH ₃
464	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
465	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
466	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
467	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
468	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
469	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
470	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
471	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
472	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH ₃
473	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH ₃
474	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
475	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH ₃
476	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
477	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
478	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
479	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
480	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
481	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
482	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH ₃
483	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃
484	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃
485	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃
486	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
487	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
488	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
489	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃
490	CH ₃	H	H	OC(CH ₃) ₃
491	CH ₃	Fenilo	H	OC(CH ₃) ₃

247
148

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
492	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OC(CH ₃) ₃
493	CH ₃	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OC(CH ₃) ₃
494	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OC(CH ₃) ₃
495	CH ₃	CH ₂ -Fenilo	H	OC(CH ₃) ₃
496	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OC(CH ₃) ₃
497	CH ₃	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OC(CH ₃) ₃
498	CH ₃	CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
499	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
500	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
501	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
502	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
503	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
504	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
505	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OC(CH ₃) ₃
506	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
507	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
508	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
509	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
510	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
511	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
512	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
513	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
514	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OC(CH ₃) ₃
515	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OC(CH ₃) ₃
516	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
517	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OC(CH ₃) ₃
518	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
519	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
520	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
521	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
522	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
523	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
524	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OC(CH ₃) ₃
525	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃
526	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃
527	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OC(CH ₃) ₃
528	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
529	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
530	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃

248
749

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
531	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OC(CH ₃) ₃
532	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
533	CH ₃	Fenilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
534	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
535	CH ₃	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
536	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
537	CH ₃	CH ₂ -Fenilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
538	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	OCH ₂ CH=CH ₂
539	CH ₃	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₂ CH=CH ₂
540	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
541	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
542	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
543	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
544	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
545	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
546	CH ₃	CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
547	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
548	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
549	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
550	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
551	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
552	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
553	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
554	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
555	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
556	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
557	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
558	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
559	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	OCH ₂ CH=CH ₂
560	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
561	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
562	CH ₃	CH ₂ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
563	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
564	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
565	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
566	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	OCH ₂ CH=CH ₂
567	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
568	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
569	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂

4

149
150

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
570	CH ₃	CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
571	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
572	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
573	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH=CH ₂
574	CH ₃	H	H	NHCH ₃
575	CH ₃	Fenilo	H	NHCH ₃
576	CH ₃	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	NHCH ₃
577	CH ₃	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	NHCH ₃
578	CH ₃	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	NHCH ₃
579	CH ₃	CH ₂ -Fenilo	H	NHCH ₃
580	CH ₃	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	NHCH ₃
581	CH ₃	CH ₂ -Ciclohexilo	H	NHCH ₃
582	CH ₃	CH ₃	H	NHCH ₃
583	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
584	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
585	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
586	CH ₃	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
587	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	NHCH ₃
588	CH ₃	CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
589	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	NHCH ₃
590	CH ₃	CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
591	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	NHCH ₃
592	CH ₃	CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
593	CH ₃	CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
594	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
595	CH ₃	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
596	CH ₃	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
597	CH ₃	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
598	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	NHCH ₃
599	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	NHCH ₃
600	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	NHCH ₃
601	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	NHCH ₃
602	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
603	CH ₃	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
604	CH ₃	CH ₂ -OH	H	NHCH ₃
605	CH ₃	CH ₂ -OCH ₃	H	NHCH ₃
606	CH ₃	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
607	CH ₃	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
608	CH ₃	CHCH ₃ -OH	H	NHCH ₃

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
609	CH ₃	CHCH ₃ -OCH ₃	H	NHCH ₃
610	CH ₃	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	NHCH ₃
611	CH ₃	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃
612	CH ₃	CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
613	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
614	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
615	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		NHCH ₃
616	CH ₃		H	NHCH ₃
617	H	H	CH ₂ CH ₂ O *	
618	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
619	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
620	H	H	CH ₂ CH ₂ NH *	
621	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
622	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
623	H	H	CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
624	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
625	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
626	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ O *	
627	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
628	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ O *	
629	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ NH *	
630	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
631	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH *	
632	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
633	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
634	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NCH ₃ *	
635	H	H	H	N(CH ₃) ₂
636	H	Fenilo	H	N(CH ₃) ₂
637	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	N(CH ₃) ₂
638	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	N(CH ₃) ₂
639	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	N(CH ₃) ₂
640	H	CH ₂ -Fenilo	H	N(CH ₃) ₂
641	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	N(CH ₃) ₂
642	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	N(CH ₃) ₂
643	H	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
644	H	CH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
645	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
646	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
647	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂

154
152

Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
648	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
649	H	CH ₂ -SH	H	N(CH ₃) ₂
650	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	N(CH ₃) ₂
651	H	CH ₂ -SCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
652	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
653	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	N(CH ₃) ₂
654	H	CH ₂ -CO-OH	H	N(CH ₃) ₂
655	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
656	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	N(CH ₃) ₂
657	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
658	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
659	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	N(CH ₃) ₂
660	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	N(CH ₃) ₂
661	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
662	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	N(CH ₃) ₂
663	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
664	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
665	H	CH ₂ -OH	H	N(CH ₃) ₂
666	H	CH ₂ -OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
667	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
668	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
669	H	CHCH ₃ -OH	H	N(CH ₃) ₂
670	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	N(CH ₃) ₂
671	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	N(CH ₃) ₂
672	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	N(CH ₃) ₂
673		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
674		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
675		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	N(CH ₃) ₂
676	H	CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
677	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
678	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
679	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		N(CH ₃) ₂
680	H	H	H	1-Pirrolidinilo
681	H	Fenilo	H	1-Pirrolidinilo
682	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	1-Pirrolidinilo
683	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	1-Pirrolidinilo
684	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	1-Pirrolidinilo
685	H	CH ₂ -Fenilo	H	1-Pirrolidinilo
686	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	1-Pirrolidinilo

47

152
153

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
687	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	1-Pirrolidinilo
688	H	CH ₃	H	1-Pirrolidinilo
689	H	CH(CH ₃) ₂	H	1-Pirrolidinilo
690	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	1-Pirrolidinilo
691	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Pirrolidinilo
692	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Pirrolidinilo
693	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Pirrolidinilo
694	H	CH ₂ -SH	H	1-Pirrolidinilo
695	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	1-Pirrolidinilo
696	H	CH ₂ -SCH ₃	H	1-Pirrolidinilo
697	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	1-Pirrolidinilo
698	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Pirrolidinilo
699	H	CH ₂ -CO-OH	H	1-Pirrolidinilo
700	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Pirrolidinilo
701	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Pirrolidinilo
702	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pirrolidinilo
703	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Pirrolidinilo
704	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Pirrolidinilo
705	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	1-Pirrolidinilo
706	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Pirrolidinilo
707	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Pirrolidinilo
708	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pirrolidinilo
709	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Pirrolidinilo
710	H	CH ₂ -OH	H	1-Pirrolidinilo
711	H	CH ₂ -OCH ₃	H	1-Pirrolidinilo
712	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pirrolidinilo
713	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Pirrolidinilo
714	H	CHCH ₃ -OH	H	1-Pirrolidinilo
715	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	1-Pirrolidinilo
716	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Pirrolidinilo
717	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Pirrolidinilo
718		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Pirrolidinilo
719		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	1-Pirrolidinilo
720		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Pirrolidinilo
721	H	CH ₂ CH ₂		1-Pirrolidinilo
722	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Pirrolidinilo
723	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Pirrolidinilo
724	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Pirrolidinilo
725	H	H	H	1-Piperidinilo

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
726	H	Fenilo	H	1-Piperidinilo
727	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	1-Piperidinilo
728	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	1-Piperidinilo
729	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	1-Piperidinilo
730	H	CH ₂ -Fenilo	H	1-Piperidinilo
731	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	1-Piperidinilo
732	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	1-Piperidinilo
733	H	CH ₃	H	1-Piperidinilo
734	H	CH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinilo
735	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinilo
736	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Piperidinilo
737	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Piperidinilo
738	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	1-Piperidinilo
739	H	CH ₂ -SH	H	1-Piperidinilo
740	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	1-Piperidinilo
741	H	CH ₂ -SCH ₃	H	1-Piperidinilo
742	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	1-Piperidinilo
743	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Piperidinilo
744	H	CH ₂ -CO-OH	H	1-Piperidinilo
745	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Piperidinilo
746	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Piperidinilo
747	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinilo
748	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinilo
749	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	1-Piperidinilo
750	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	1-Piperidinilo
751	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	1-Piperidinilo
752	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	1-Piperidinilo
753	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinilo
754	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinilo
755	H	CH ₂ -OH	H	1-Piperidinilo
756	H	CH ₂ -OCH ₃	H	1-Piperidinilo
757	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinilo
758	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinilo
759	H	CHCH ₃ -OH	H	1-Piperidinilo
760	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	1-Piperidinilo
761	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	1-Piperidinilo
762	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	1-Piperidinilo
763		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Piperidinilo
764		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	1-Piperidinilo

154
755

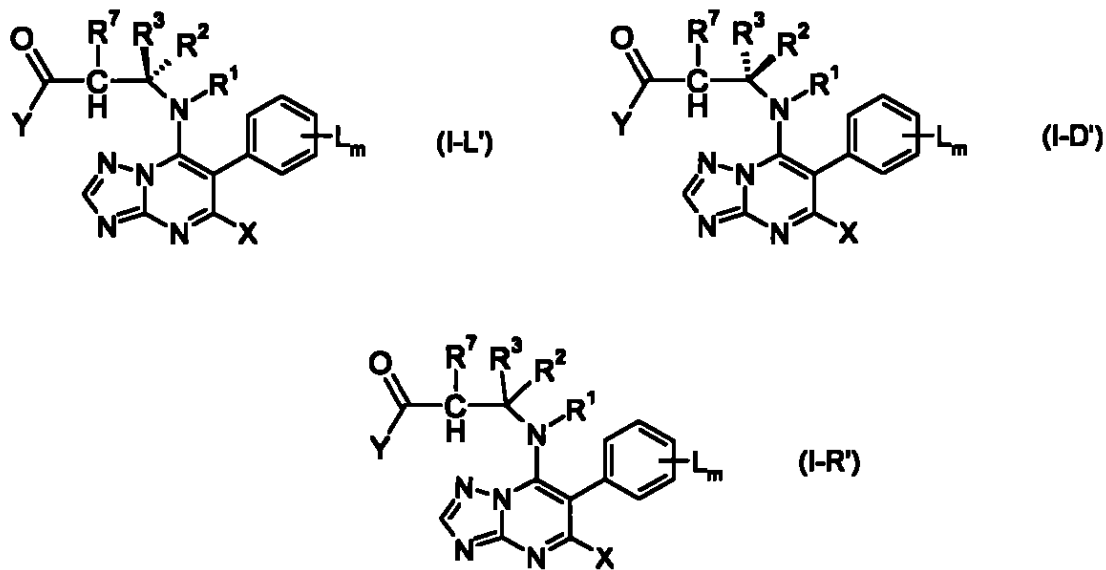
Nº	R ¹	R ²	R ³	Y
765		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1-Piperidinilo
766	H	CH ₂ CH ₂		1-Piperidinilo
767	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Piperidinilo
768	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Piperidinilo
769	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		1-Piperidinilo
770	H	H	H	Morfolin-4-ilo
771	H	Fenilo	H	Morfolin-4-ilo
772	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	Morfolin-4-ilo
773	H	CH ₂ -(5-Hidroxiindol-3-ilo)	H	Morfolin-4-ilo
774	H	CH ₂ -(Imidazol-4-ilo)	H	Morfolin-4-ilo
775	H	CH ₂ -Fenilo	H	Morfolin-4-ilo
776	H	CH ₂ -(4-OH-Fenilo)	H	Morfolin-4-ilo
777	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	Morfolin-4-ilo
778	H	CH ₃	H	Morfolin-4-ilo
779	H	CH(CH ₃) ₂	H	Morfolin-4-ilo
780	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Morfolin-4-ilo
781	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Morfolin-4-ilo
782	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Morfolin-4-ilo
783	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Morfolin-4-ilo
784	H	CH ₂ -SH	H	Morfolin-4-ilo
785	H	CH ₂ -CH ₂ -SH	H	Morfolin-4-ilo
786	H	CH ₂ -SCH ₃	H	Morfolin-4-ilo
787	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	Morfolin-4-ilo
788	H	CH ₂ -CO-NH ₂	H	Morfolin-4-ilo
789	H	CH ₂ -CO-OH	H	Morfolin-4-ilo
790	H	CH ₂ -CO-OCH ₃	H	Morfolin-4-ilo
791	H	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	Morfolin-4-ilo
792	H	CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	Morfolin-4-ilo
793	H	CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	Morfolin-4-ilo
794	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-NH ₂	H	Morfolin-4-ilo
795	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OH	H	Morfolin-4-ilo
796	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	Morfolin-4-ilo
797	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	Morfolin-4-ilo
798	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂	H	Morfolin-4-ilo
799	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	Morfolin-4-ilo
800	H	CH ₂ -OH	H	Morfolin-4-ilo
801	H	CH ₂ -OCH ₃	H	Morfolin-4-ilo
802	H	CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂	H	Morfolin-4-ilo
803	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	Morfolin-4-ilo

148
756

N°	R ¹	R ²	R ³	Y
804	H	CHCH ₃ -OH	H	Morfolin-4-ilo
805	H	CHCH ₃ -OCH ₃	H	Morfolin-4-ilo
806	H	CHCH ₃ -OCH(CH ₃) ₂	H	Morfolin-4-ilo
807	H	CHCH ₃ -OC(CH ₃) ₃	H	Morfolin-4-ilo
808		CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Morfolin-4-ilo
809		CH ₂ CH(OH)CH ₂	H	Morfolin-4-ilo
810		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Morfolin-4-ilo
811	H	CH ₂ CH ₂		Morfolin-4-ilo
812	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		Morfolin-4-ilo
813	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		Morfolin-4-ilo
814	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		Morfolin-4-ilo

* el heteroátomo está adosado al átomo de carbono del grupo carbonilo

Otros ejemplos de compuestos de preferencia de la fórmula I de acuerdo con la invención son los enantiómeros de las fórmulas I-L' e I-D' y el racemato de la fórmula I-R' en el cual R⁷ es hidrógeno o metilo, X y L_m tienen los significados dados en las tablas 1 a 60 y las variables R¹, R², R³ e Y en cada caso tiene juntos el significado dado en una de las hileras 1 a 814 de la tabla A:



Otros ejemplos de compuestos de preferencia de la fórmula I de

156
154

acuerdo con la invención son los enantiómeros de la fórmula I-L" e I-D" y el racemato de la fórmula I-R", en donde L_m y X tienen los significados dados en las tablas 1 a 60 y la variable Y tiene en cada caso junto el significado dado en una de las hileras 1 a 16 de la tabla A':

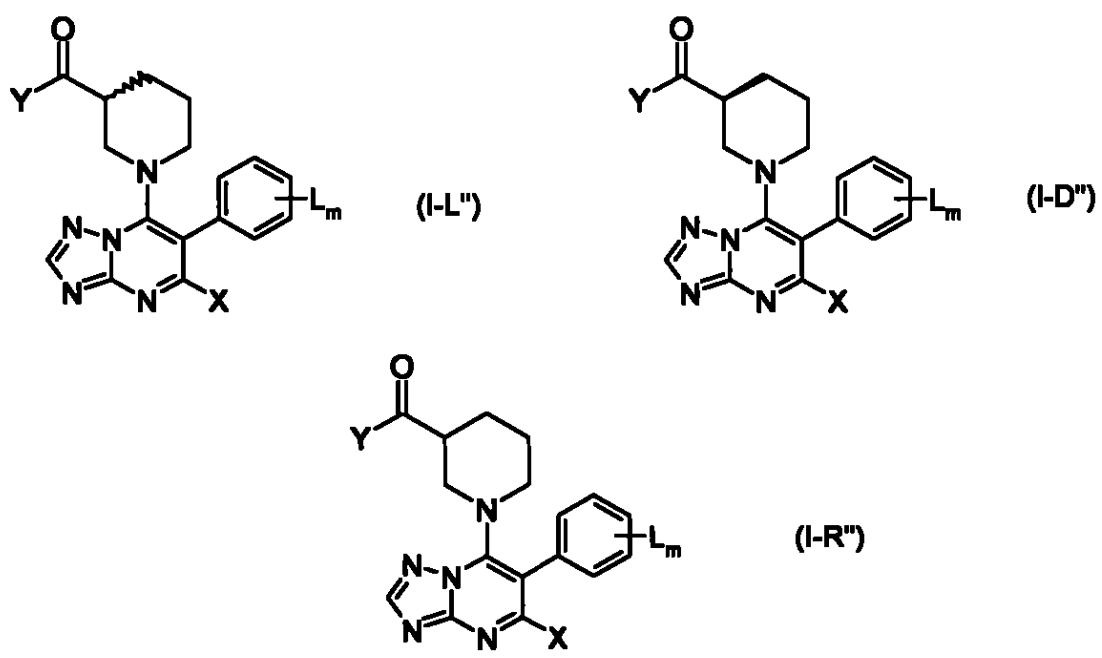


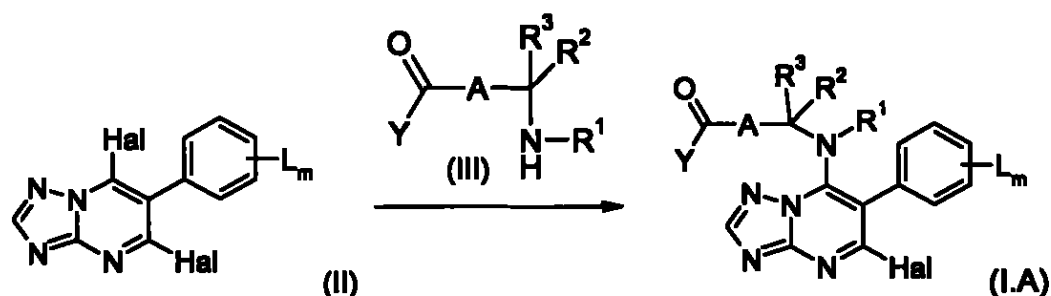
Tabla A':

Nº	Y
1	OH
2	OCH ₃
3	OCH ₂ CH ₃
4	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
5	OCH=CH-CH ₃
6	OCH(CH ₃) ₂
7	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
8	OC(CH ₃) ₃
9	OCH ₂ C ₆ H ₅
10	NH ₂
11	NHCH ₃
12	NHCH ₂ CH ₃
13	N(CH ₃) ₂
14	1-pirrolidinilo
15	1-piperidinilo
16	morfolin-4-ilo

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden obtener por diferentes vías. Los compuestos I, en donde X es halógeno y W es oxígeno (compuestos I.A) en general se preparan por reacción de 5,7-dihalo-1,2,4-triazolopirimidinas de la fórmula II con derivados de ácido 5 aminocarboxílico de la fórmula III, de acuerdo con el método que se

muestra en el esquema 1:

Esquema 1:



En el Esquema 1, R^1-R^3 , L , m e Y son como se definió antes. Hal es halógeno, en particular cloro. La reacción de II con derivados de ácidos aminocarboxílicos se realiza de preferencia de 0°C a 70°C , de preferencia de 10°C a 35°C , de preferencia en presencia de un solvente inerte, tal como un éter, por ejemplo dioxano, éter dietílico o, en particular, tetrahidrofurano, un hidrocarburo halogenado tal como diclorometano, o un hidrocarburo aromático, tal como, por ejemplo, tolueno [cf. WO 98/46608; WO 02/48151].

Se prefiere el uso de una base tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina, o una base inorgánica, tal como carbonato de potasio; también es posible usar como base un exceso de ácido aminocarboxílico de la fórmula III.

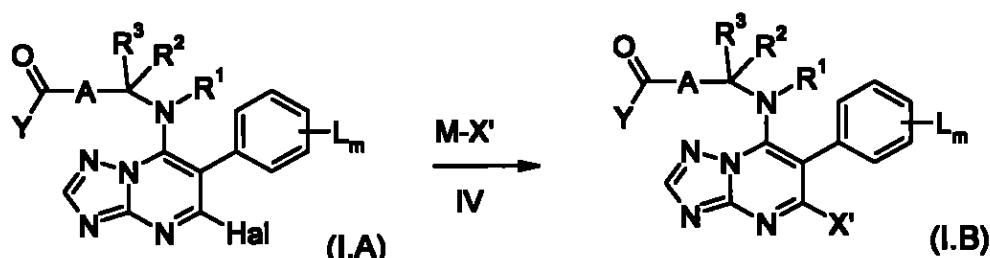
Los derivados de aminoácidos de la fórmula III son conocidos, y la mayoría de ellos están disponibles en el comercio o se pueden preparar por métodos conocidos para preparar y derivar aminoácidos. Las 5,7-dihalo-2,2'-bipirimidinas de la fórmula II son conocidas del arte previo citado en el anexo, o se pueden preparar de manera análoga a los métodos allí descritos.

Los compuestos de la fórmula I, en donde X es ciano o alcoxi C_1-

159
760

C₄ (fórmula 1.13) se pueden preparar con ventaja a partir de compuestos I.A mediante el método que se muestra en el esquema 2.

Esquema 2:



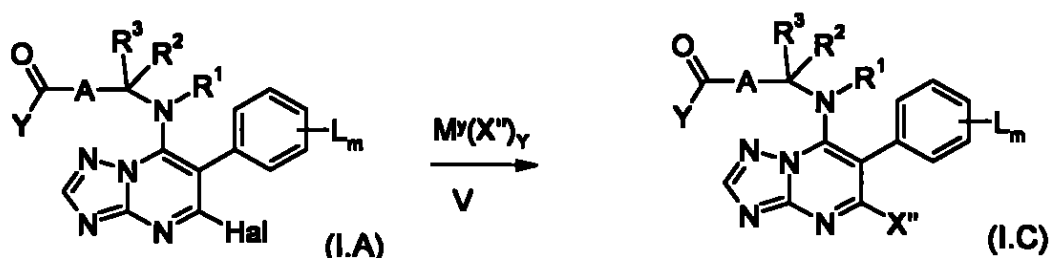
En el esquema 2, R¹-R³, Hal, L, m e Y son como se definió antes. X' es cianuro, alcóxido C₁-C₄ o haloalcóxido C₁-C₄. La reacción se lleva a cabo con ventaja en presencia de un solvente inerte. El catión M de la fórmula IV tiene escasa importancia; por razones prácticas se suelen preferir amonio, tetraalquilamonio o sales de metales alcalinos o alcalinotérreos. La temperatura de reacción suele ser de 0 a 120°C, de preferencia de 10 a 40°C [cf. J. Heterocycl. Chem. 12 (1975), 861-863]. Entre los solventes adecuados se cuentan éteres tales como dioxano, éter dietílico y, de preferencia, tetrahidrofurano, un hidrocarburo halogenado tal como diclorometano, o un hidrocarburo aromático, tal como, por ejemplo, tolueno.

Los compuestos I, en donde X es alquilo C₁-C₄ (fórmula I.C) se puede preparar con ventaja a partir de los materiales de inicio de la I.A, por las vías señaladas a continuación.

Los compuestos de la fórmula I.C, en donde X'' alquilo C₁-C₄ se pueden obtener, por ejemplo, por acoplamiento de 5-halotriazolopirimidinas de la fórmula I.A con reactivos organometálicos de la fórmula V (ver esquema 3). En una forma de realización de este proceso, la se lleva a cabo por catálisis con metal de transición metal, por

ejemplo en presencia de cantidades catalíticas de compuestos de Ni o Pd.

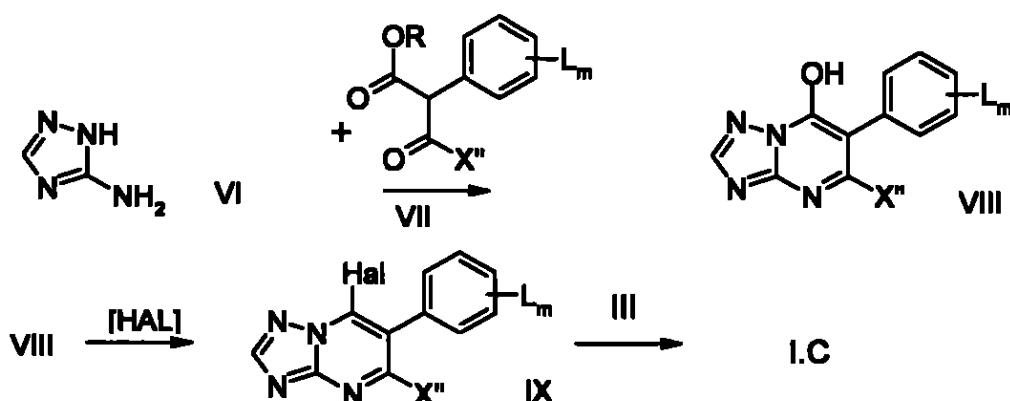
Esquema 3:



En las fórmulas I.C y V, X'' es alquilo C₁-C₄ y M es un ion metálico de valencia Y, tal como, por ejemplo, B, Zn o Sn. Esta reacción se puede realizar, por ejemplo, en forma análoga a los siguientes métodos: J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, (1994), 1187, *ibid.* 1 (1996), 2345; WO 99/41255; Aust. J. Chem. 43 (1990), 733; J. Org. Chem. 43 (1978), 358; J. Chem. Soc., Chem. Commun. (1979), 866; Tetrahedron Lett. 34 (1993), 8267; *ibid.* 33 (1992), 413.

Los compuestos de la fórmula I, en donde X es alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ (fórmula I.C), también se pueden preparar con ventaja por la siguiente vía de síntesis, mostrada en el esquema 4:

Esquema 4:



En el esquema 4, R¹-R³, L, m e Y son como se definió antes. Hal

16f
162

es, en particular, cloro o bromo, X" es alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ y R es alquilo C₁-C₄, en particular metilo o etilo.

En una primera etapa, por los métodos conocidos per se, por reacción de 5-aminotriazol VI con el cetoéster VII, se prepara una 5-alquil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidina VIII [cf. Chem. Pharm. Bull. 9 (1961), 801]. El 5-aminotriazol VI usado está disponible en el comercio. Los materiales de inicio VII se preparan con ventaja según las condiciones conocidas del documento EP-A 10 02 788.

Las 5-alquil-7-hidroxi-6-feniltriazolopirimidinas VIII obtenidas de esta manera se hacen reaccionar, en una segunda etapa, con agentes halogenantes [HAL] para obtener 7-halotriazolopirimidinas de la fórmula IX. Los agentes halogenantes de preferencia son agentes clorantes o bromantes, tales como oxibromuros de fósforo, oxiclورو de fósforo, cloruro de tionilo, bromuro de tionilo o cloruro de sulfurilo. La reacción se puede realizar pura o en presencia de un solvente. Las temperaturas de reacción habituales son de 0 a 150°C o, de preferencia, de 80 a 125°C.

La reacción de la 7-halotriazolopirimidina IX con el derivado de ácido aminocarboxílico de la fórmula III se realiza con ventaja de 0°C a 70°C, en particular de 10°C a 35°C. La reacción se realiza de preferencia en presencia de un solvente inerte, tal como éter, por ejemplo dioxano, éter dietílico o, en particular, tetrahydrofurano, un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano, un hidrocarburo aromático, tal como, por ejemplo, tolueno, xilenos, etc. [cf. WO 98/46608].

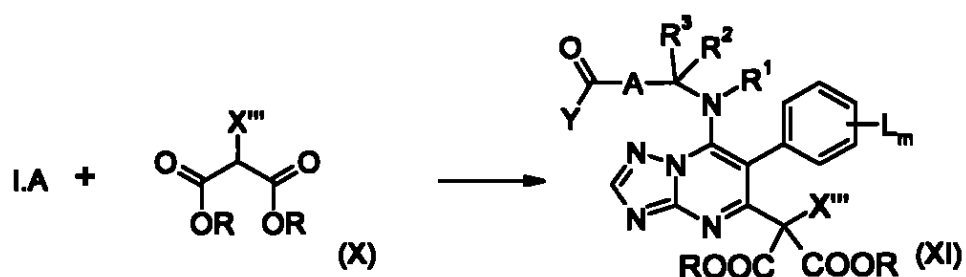
Se prefiere usar una base, por ejemplo una amina terciaria, por ejemplo trietilamina, o una base inorgánica, por ejemplo carbonato de potasio; también es posible usar exceso del derivado de ácido

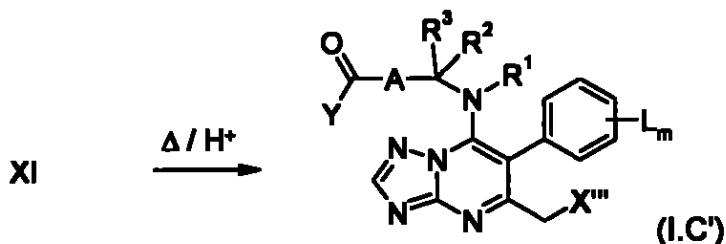
162
763

aminocarboxílico de la fórmula III como base.

Como alternativa, los compuestos de la fórmula I.C también se pueden preparar por reacción de los compuestos I.A con malonatos de dialquilo de la fórmula X, seguido de decarboxilación, de acuerdo con el método que se muestra en el esquema 5 [cf. US 5 994 360].

Esquema 5:





En el esquema 5, R^1 – R^3 , L , m e Y son como se definió antes. X''' es hidrógeno, alquilo C_1 – C_3 o haloalquilo C_1 – C_3 y R es alquilo C_1 – C_4 .

En la primera etapa, el compuesto I.A se hace reaccionar con malonato de dialquilo de la fórmula X, de preferencia en presencia de una base, o con la sal de X. Se obtiene así el compuesto XI. La reacción se puede realizar en forma análoga al proceso descrito en el documento US 5 994 360. Los malonatos X con conocidos en la bibliografía [J. Am. Chem. Soc. 64 (1942), 2714; J. Org. Chem. 39 (1974), 2172; Helv. Chim. Acta 61 (1978), 1565], o se puede preparar de acuerdo con la bibliografía citada.

La posterior hidrólisis del éster XI se realiza en las condiciones habituales [cf. US 5 994 360]. De acuerdo con los diversos elementos estructurales, puede ser ventajosa la hidrólisis alcalina o ácida de los compuestos XI. En las condiciones de hidrólisis de éster, puede ya haber descarboxilación parcial o completa a I.C'. La descarboxilación se suele realizar a temperaturas de 20°C a 180°C, de preferencia de 50°C a 120°C, en un solvente inerte, de ser adecuado en presencia de un ácido. Los ácidos adecuados son ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido p-toluensulfónico. Los solventes adecuados son agua, hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano y éter de petróleo, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, o, m y p-xileno, hidrocarburos

halogenados, tales como cloruro de metileno, cloroformo y clorobenceno, éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter ter-butilmetílico, dioxano, anisol y tetrahidrofurano, nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, dietilcetona y ter-butilmetilcetona, alcoholes tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y ter-butanol, y también dimetilsulfóxido, dimetilformamida y dimetilacetamida; con particular preferencia, la reacción se realiza en ácido clorhídrico o ácido acético. También es posible usar mezclas de los solventes mencionados.

Las mezclas de reacción obtenidas por los métodos que se muestran en los esquemas 1 a 5 se procesan de la forma habitual, por ejemplo por mezcla con agua, separación de fases y, si corresponde, purificación cromatográfica de los productos crudos. Algunos de los productos intermediarios y finales se obtienen en la forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente parduscos, que se puede purificar o liberar de los componentes volátiles bajo presión reducida y con temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermediarios y finales se obtienen como sólidos, la purificación también se puede hacer por recristalización o digestión.

Si alguno de los compuestos I no se puede obtener por las vías antes descritas, se pueden preparar por derivación de otros I.

Si la síntesis produce mezclas de isómeros, por lo general no se requiere necesariamente una separación, dado que en algunos casos los isómeros individuales se pueden interconvertir durante el procesamiento o el uso (por ejemplo, por acción de la luz, de ácidos o de bases). Dichas conversiones pueden tener lugar después del uso, por ejemplo en el caso de tratamientos de plantas en la planta tratada, o de los hongos dañinos

que se quieren controlar.

Los compuestos I son adecuados como fungicidas. Se distinguen por su notable efectividad contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, en especial de las clases de *Ascomycetes*, *Deuteromycetes*, *Oomycetes* y *Basidiomycetes*. Algunos tienen efectividad sistémica y se pueden usar para la protección de plantas como fungicidas foliares y del suelo.

Tienen particular importancia para el control de numerosos hongos de diversas plantas cultivadas, tales como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, bananas, algodón, soja, café, caña de azúcar, vides, frutos y plantas ornamentales, y vegetales, tales como pepinos, porotos, tomates, papas y cucurbitáceas, y de las semillas de estas plantas.

Son especialmente adecuadas para el control de las siguientes enfermedades de plantas:

- *Alternaria* species en frutas y verduras
- *Bipolaris* y *Drechslera* species en cereales, arroz y céspedes
- *Blumeria graminis* (moho pulverulento) en cereales
- *Botrytis cinerea* (moho gris) en frutillas, verduras plantas ornamentales y vides
- *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas
- *Fusarium* y *Verticillium* species en diversas plantas
- *Mycosphaerella* species en cereales, bananas y maníes
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates
- *Plasmopara viticola* en vides
- *Podosphaera leucotricha* en manzanas
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada

- *Pseudoperonospora* species en lúpulo y pepinos
- *Puccinia* species en cereales
- *Pyricularia oryzae* en arroz
- *Rhizoctonia* species en algodón, arroz y césped
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo
- *Uncinula necator* en vides
- *Ustilago* species en cereales y caña de azúcar y
- *Venturia* species (ácaros) en manzanas y peras.

Los compuestos I son adecuados para el control de hongos dañinos, tales como *Paecilomyces variotii*, en la protección de materiales (p. ej. madera, papa, dispersadores de pintura, fibras o tejidos) y en la protección de productos almacenados.

Los compuestos I se utilizan por tratamiento de los hongos o las plantas, semillas, materiales o suelo que se desea proteger contra el ataque de hongos mediante una cantidad con actividad fungicida de los compuestos activos. La aplicación se puede hacer antes y después de la infección de los materiales, plantas o semillas por los hongos.

Las composiciones fungicidas generalmente comprenden entre 0,1 y 95%, de preferencia entre 0,5 y 90%, en peso de compuesto activo.

Cuando se emplea en la protección de plantas, las cantidades aplicadas son, según el tipo de efecto deseado, entre 0,01 y 2,0 kg de compuesto activo por ha.

En el tratamiento de semillas, por lo general se requieren cantidades de compuesto activo de 0,001 a 0,1 g, de preferencia 0,01 a 0,05 g, por kilogramo de semilla.

Cuando se usa en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de compuesto activo aplicado depende el tipo

de superficie de aplicación y del efecto buscado. Las cantidades habituales aplicadas para la protección de materiales son, por ejemplo, 0,001 g a 2 kg, de preferencia 0,005 g a 1 kg, de compuesto activo por metro cúbico de material tratado.

Los compuestos I se pueden convertir en las formulaciones habituales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizaciones, pastas y gránulos. La forma de aplicación depende del objetivo particular; en cada caso, debe asegurar una distribución fina y uniforme del compuesto de acuerdo con la invención.

Las formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo al extender el compuesto activo con solventes y/o portadores, si se desea, mediante emulsionantes y dispersantes. Los solventes/auxiliares adecuados son esencialmente:

- agua, solventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma butirrolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (glicoldiacetato), glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos. En principio, también se pueden usar mezclas de solventes,
- portadores tales como minerales naturales molidos (por ejemplo caolines, arcillas, talco, tiza) y minerales sintéticos molidos (por ejemplo sílice muy disperso, silicatos); emulsionantes tales como emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de alcoholes ácidos de polioxietileneo, alquilsulfonatos y arilsulfonatos) y dispersantes tales como licores de restos de

lignosulfito y metilcelulosa.

Los agentes tensioactivos adecuados con sales de metales alcalinos, metales alcalinotérreos y de amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquilo, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, éteres de ácidos grasos y glicolsulfatados de alcoholes grasos, además condensados de naftaleno sulfonatado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, éter polioxietilenoctilfenol, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, éteres de alquilfenolpoliglicol, éter tributilfenilpoliglicol, éter tristearilfenilpoliglicol, poliéteres de alquilarilo alcohol, condensados de alcohol y alcohol ácido/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres de polioxietilenalquilo, polioxipropileno etoxilado, acetal de laurilalcohol éter poliglicol, ésteres de sorbitol, licores de restos de lignosulfito y metilcelulosa.

Para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite adecuados rociables directamente se usan fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tal como querosén o dieseloil, además aceites de alquitrán de carbón y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, solventes muy polares, por ejemplo dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona y agua.

Los polvos, materiales para dispersión y productos pulverizables se pueden preparar por mezclado o concomitante molienda de las sustancias

169
170

activas con un portador sólido.

Los gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, se pueden preparar por unión de los compuestos activos a portadores sólidos. Son ejemplos de portadores sólidos las tierras minerales tales como gel de sílice, silicatos, talco, caolín, arcilla, caliza, cal, tiza, arcilla fina, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas, y productos de origen vegetal, tales como harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvo de celulosa y otros portadores sólidos.

En general, las formulaciones comprenden de 0,01 a 95% en peso, de preferencia de 0,1 a 90% en peso, del compuesto activo. Los compuestos activos se emplean en una pureza de 90% a 100%, de preferencia 95% a 100% (de acuerdo con el espectro de RMN).

Los ejemplos de formulaciones incluyen productos para la dilución con agua, por ejemplo,

A Concentrados hidrosolubles (SL)

10 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se disuelven en agua o en un solvente hidrosoluble. Como alternativa, se agregan humidificantes u otros auxiliares. El compuesto activo se disuelve por dilución con agua;

B Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se disuelven en ciclohexanona con adición de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión;

C Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se disuelven en xileno con el agregado de dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5%). La dilución con agua da una emulsión;

D Emulsiones (EW, EO)

40 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se disuelven en xileno con el agregado de dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5%). Esta mezcla se introduce en agua mediante una máquina emulsionante (Ultraturax) y se transforma en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión;

E Suspensiones (SC, OD)

En un molino con esferas en agitación se mezclan 20 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención, con el agregado de dispersantes, humectantes y agua o un solvente orgánico, para dar una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo;

F Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

50 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se muelen finamente con agregado de dispersantes y humectantes, y se transforman en gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua mediante instrumentos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de rocío, lecho fluido). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo;

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

131
472

75 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se muelen en un molino estator rotatorio con la adición de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo; y productos para aplicar sin dilución, por ejemplo,

H Polvos pulverizables (DP)

5 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se muelen finamente y se mezclan íntimamente con 95% de caolín finamente dividido. Así se obtiene un producto pulverizable;

I Gránulos (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se muele finamente y se asocia con 95,5% de portadores. Los métodos actuales son extrusión, secado por rocío o lecho fluido. Se obtienen gránulos para aplicar sin dilución;

J Soluciones ULV (UL)

10 partes en peso de un compuesto de acuerdo con la invención se disuelven en un solvente orgánico, por ejemplo xileno. Se obtiene un producto que se puede aplicar sin diluir.

Los compuestos activos se pueden usar como tales, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de ellos, por ejemplo en la forma de soluciones rociables directamente, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite, pastas, productos pulverizables, materiales para dispersión, o gránulos, por medios de rociado, atomizado, pulverizado, dispersión o volcado. Las formas de uso dependen totalmente de los objetivos pretendidos; la intención es asegurar en cada caso la distribución más fina posible de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

Las formas de uso acuoso se pueden preparar a partir de concentrados de emulsiones, pastas o polvos humectables (polvos dispersables, dispersiones de aceite) por agregado de agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite se pueden homogeneizar las sustancias en agua, como tales o disueltas en un aceite o solvente, mediante un humectante, disolvente, dispersante o emulsionante. Como alternativa, también es posible preparar concentrados compuestos por sustancias activas, humectantes, disolventes, dispersantes o emulsionantes y, si corresponde, un solvente o aceite, y dichos concentrados son adecuados para la dilución en agua.

Las concentraciones de compuesto activo en las preparaciones litas para usar se pueden variar dentro de rangos relativamente amplios. En general, son de 0,0001 a 10%, de preferencia de 0,01 a 1 %.

Los compuestos activos también se pueden usar con éxito con el método de volumen ultra bajo (ULV), por el cual es posible aplicar formulaciones que comprenden más del 95% en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Se pueden agregar diversos tipos de aceites, agentes humectantes, coadyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, o bactericidas a los compuestos activos, si es adecuado no hasta inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Estos agentes se pueden mezclar con los agentes de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1.

Las composiciones de acuerdo con la invención también pueden estar presentes, en la forma de uso como fungicidas, junto con otros compuestos activos, p. ej. con herbicidas, insecticidas, reguladores del crecimiento, fungicidas o con fertilizantes. La mezcla de los compuestos I las composiciones que los comprenden, en la forma de uso de

fungicidas, con otros fungicidas da por resultado en muchos casos una expansión del espectro fungicida de la actividad obtenida.

La siguiente lista de fungicidas, en conjunción con la cual se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero sin limitaciones:

- acilalaninas, tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace o oxadixilo,
- derivados amina, tales como aldimorfo, dodina, dodemorfo, fenpropimorfo, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina o tridemorfo,
- anilinopirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinilo,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomicina,
- azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol o triticonazol,
- dicarboximidas, tales como iprodiona, miclozolina, procimidona o vinclozolina,
- ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamato, tiram, ziram o zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilazina, benomilo, boscalid, carbendazim, carboxin, oxicarboxin, ciazofamid, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mepronilo,

nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato de metilo, tiadinilo, triciclazol o triforina,

- fungicidas de cobre, tales como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre o sulfato básico de cobre,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacril, dinocap, dinobutona o nitroftalisopropilo,
- fenilpirroles, tales como fenciclonilo o fludioxonilo,
- azufre,
- otros fungicidas, tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, acetato de fentina, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, fosetilo, fosetilaluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicuron, propamocarb, ftalida, toloclofosmetilo, quintoceno o zoxamida,
- estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoximmetilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- derivados de ácido sulfénico, tales como captafol, captan, diclofluanida, folpet o tolilfluanida,
- cinnamidas y compuestos análogos, tales como dimetomorfo, flumetover o flumorfo.

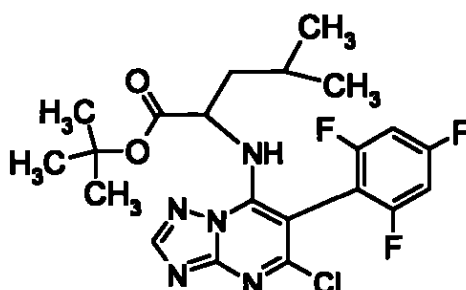
Ejemplos de síntesis

Los procedimientos descritos en los ejemplos de síntesis siguientes se usan para obtener otros compuestos para la adecuada modificación de los materiales de inicio. Los compuestos así obtenidos se enumeran en

175
776

las tablas siguientes, junto con los datos físicos.

Ejemplo 1:



A temperatura ambiente, 32,57 μ l (0,235 mmol) de trietilamina se agregan a una mezcla de 75 mg (0,235 mmol) de 5,7-dicloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidina y 44 mg (0,235 mmol) de ter-butilo-2-amino-4-metilpentanoato en 2 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante la noche. Luego se extrae la mezcla dos veces con 5 ml por vez de solución de cloruro de sodio al 5%. La fase orgánica se separa, se seca y se concentra a presión reducida, para obtener el compuesto del título en un rendimiento de > 90%.

Los compuestos de la fórmula Ia (compuestos I, X es cloro y A es un enlace químico, y Ib (compuestos I, X es cloro y A es un grupo CHR^7) listado en las tablas B y C a continuación se preparan mediante el procedimiento dado en el ejemplo 1.

Todos los productos se caracterizan por espectrometría de masa/HPLC combinados. Se usa una columna analítica RP-18 (Chromolith Speed ROD de Merck KGaA, Alemania), que opera a 40°C, para HPLC. La fase móvil usada es acetonitrilo con 0,1 % en volumen de ácido trifluoroacético y una mezcla 0,1 % en volumen de ácido trifluoroacético/agua (durante 5 min, se cambió la proporción de ácido

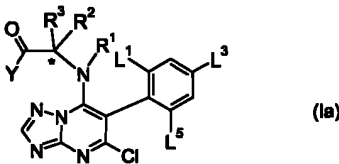
71

~~178~~
177

trifluoroacético/agua de 5:95 a 95:5). Se realizó la espectrometría de masa mediante un espectrómetro de masa de cuatro polos con ionización de electrospray a 80V en el modo positivo.

172

Tabla B.



E _j	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁵	* ¹⁾	mln ²⁾ / m/z ³⁾
1	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	rac	4,08 / 470,10
2	H	H	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	—	3,37 / 414,00
3	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,61 / 428,00
4	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,41 / 428,00
5	H	CH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	2,96 / 386,00
6	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,56 / 428,00
7	H	CH ₂ -Indol-3-yl	H	OCH ₃	F	F	F	S	2,46 / 501,00
8	H	CH ₂ -Phenyl	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,54 / 462,00
9	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	S	3,86 / 456,00
10	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	2,87 / 386,00
11	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,17 / 446,00
12	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OCH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	2,95 / 458,00

778

Ej	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁵	* 1)	mln ²⁾ / m/z ³⁾
13	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	3,08 / 400,00
14	CH ₃	H	H	NHCH ₃	F	F	F	—	2,40 / 385,00
15	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₂ CH=CH ₂	F	F	F	S	3,74 / 454,00
16	H	CH ₂ -Indol-3-ilo	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,62 / 515,00
17	H	CH ₂ -Penilo	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,69 / 476,00
18	H	CH ₃	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	rac	3,60 / 428,00
19	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	rac	3,78 / 488,00
20	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	S	3,98 / 456,10
21	H	Femlo	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,49 / 448,00
22	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,25 / 446,00
23	H	CH ₂ CH ₂		OCH ₃	F	F	F	rac	3,07 / 412,00
24	H	CH ₂ -CH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,54 / 486,00
25	H	CH ₂ -Ciclohexilo	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,84 / 486,00
26	H	CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂	F	F	F	S	3,41 / 472,00
27	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₂ -Femlo	F	F	F	S	3,97 / 504,10
28	H	CH(CH ₃) ₂	H	OC(CH ₃) ₃	F	F	F	S	3,85 / 456,00
29	H	CH ₂ -OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,51 / 458,00
30	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,61 / 441
31		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	OCH ₃	F	F	H	rac	—
32	H	H		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ⁵⁾	F	F	F	rac	2,74 / 410
33	H	H	H	OH	F	F	F	—	2,35 / 357
34	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	3,66 / 454

72

Sincerely yours,

CAVELIER ABOGADOS

Oscar Correa
Department Head
Tel. Ext. 2269
oscarcorrea@cavelier.com

Felipe Bedoya
Lawyer
Tel. Ext. 2303
felipebedoya@cavelier.com

Ej	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁵	* ¹⁾	min ²⁾ / m/z ³⁾
35	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	—	3,72 / 475
36	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,90 / 455
37	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,53 / 427
38	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,22 / 469
39	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,91 / 455
40	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	R	3,78 / 441
41	H	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,14 / 399
42	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	H	Cl	S	3,38 / 411
43	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	H	Cl	S	3,53 / 425
44	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₃	F	H	Cl	S	3,61 / 425
45	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	S	3,42 / 423
46	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	S	3,57 / 437
47	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ ⁴⁾	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	S	3,64 / 437
48	H	CH(CH ₃)	H	OH	Cl	OCH ₃	H	S	3,42 / 423
49	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	R	3,63 / 441
50	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	R	3,81 / 455
51	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,74 / 441
52	H	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	R	3,33 / 413
53	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	R	3,44 / 427
54	H	C(CH ₃) ₃	H	NHCH ₃	F	F	F	rac	2 95 / 426
55	H	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	F	F	F	S	3,70 / 441
56	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,53 / 424

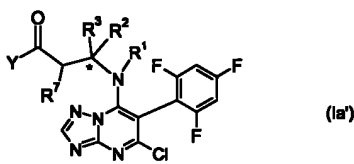
159

Ej	R ¹	R ²	R ³	Y	L ¹	L ³	L ⁵	* ¹⁾	min ²⁾ / m/z ³⁾
57	H	H		CH ₂ CH ₂ O ⁵⁾	F	F	F	rac	2,64 / 382
58	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,70 / 441
59	CH ₃	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	F	F	F	S	3,70 / 441
60	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	F	F	F	R	3,61 / 427
61	H	C(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	F	F	F	rac	3,56 / 427
62	H	CF ₃	H	H	F	F	F	rac	2,85 / 425

- 1) configuracion en el atomo de carbono α
- 2) tiempo de retencion HPLC en minutos
- 3) m/z del pico [M+H]⁺
- 4) configuración del atomo de carbono quiral en la cadena lateral R²
- 5) heteroátomo adosado al grupo carbonilo

Los compuestos de la fórmula la' (compuestos I, en donde L_m es 2,4,6-trifluoro, X es cloro y A es un grupo CHR⁷⁾ listados en la tabla C siguiente se prepararon segun el procedimiento dado para el ejemplo 1

Tabla C

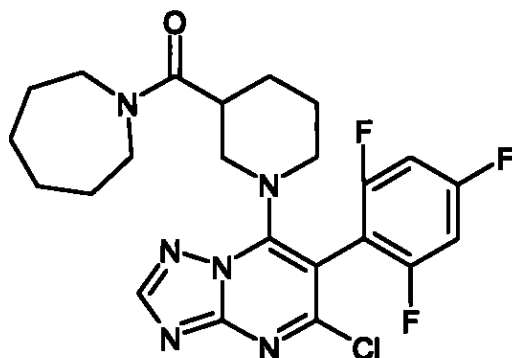


Ej	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	* ¹⁾	min ²⁾ /m/z ³⁾
63	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	rac	3,49
64	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	—	2,79 / 386
65	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	rac	3,21 / 414
66	H	H	H	H	OC(CH ₃) ₂	—	3,48 / 428
67	H	H	fenilo	H	OCH ₃	rac	3,50 / 448
68	H	H	4-isopropilfenilo	H	OCH ₃	rac	3,95 / 504
69	H	H	4-fluorofenilo	H	OCH ₃	rac	3,45 / 480
70	H	H	4-metilfenilo	H	OCH ₃	rac	3,60 / 476
71	H	H	2-naftilo	H	OCH ₃	rac	3,69 / 512

1) configuracion en el atomo de carbono α

2) Tiempo de retencion HPLC en minutos

3) m/z del pico [M+H]⁺

Ejemplo 72

Tiempo de retención HPLC en minutos: 3,42.

m/z: 492 [M+H]⁺

Los compuestos activos se preparan como solución madre que comprende 0,25% en peso del compuesto activo en acetona o DMSO. Se agrega 1 % en peso del emulsionante Uniperol® EL 10 (agente humectante con acción emulsionante y dispersante basada en alquilfenoles etoxilados) a esta solución, y la mezcla se diluye con agua hasta la concentración deseada.

Ejemplo de uso 1 – Actividad contra acción temprana causada por *Alternaria solani*

Se rocían las hojas de plantas de tomate del cultivar “golden princess” hasta el punto de chorreo, con una suspensión acuosa con la concentración de compuesto activo establecida antes. Al día siguiente se infectan las plantas tratadas con una suspensión de esporas de *Alternaria solani* en una solución acuosa de biomalta al 2%, con una densidad de $0,17 \times 10^6$ esporas/ml. Las plantas de prueba luego se colocaron en una cámara

saturada de vapor a temperaturas de 20 a 22°C. Después de 5 días, la enfermedad de las plantas no tratadas, pero infectadas, había desarrollada a tal grado que se podía determinar la infección visualmente.

En esta prueba, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos activos de los ejemplos 3, 4, 37, 42, 52, 56, 13, 30, 43, 45, 46, 47 mostraron escasa, o ninguna infección, hasta un máximo de 15%, mientras que las plantas no tratadas estaban afectadas en un 90%.

Ejemplo de uso 2 – Actividad contra moho gris en hojas de pimienta causada por *Botrytis cinerea*, aplicación protectora

Las hojas de pimienta del cultivar “Neusiedler Ideal Elite” fueron rociadas, después del desarrollo de 2 a 3 hojas, hasta punto de chorreo con una suspensión acuosa con la concentración de compuesto activo antes establecida. Al día siguiente se inocularon las plantas tratadas con una suspensión de esporos de *Botrytis cinerea* en una solución acuosa de biomalta al 2%, con una densidad de $0,17 \times 10^6$ esporas/ml. Luego se colocaron las plantas en una cámara climatizada a temperaturas entre 22 y 24°C y elevada humedad atmosférica. Después de 5 días se determinó visualmente la extensión de la infección fúngica por la superficie afectada por la infección de la hoja.

En esta prueba, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos activos de los ejemplos 3, 4, 6, 11, 15, 25, 26, 30, 33, 35, 37, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 10 51, 52, 54, 55, 56, 60, 61 no mostraron infección, o muy escasa, es decir, inferior al 10%, mientras que las plantas no tratadas estaban al menos 80% infectadas.

Ejemplo de uso 3 – Actividad curativa contra herrumbre pardo de trigo

causado por *Puccinia recondita*

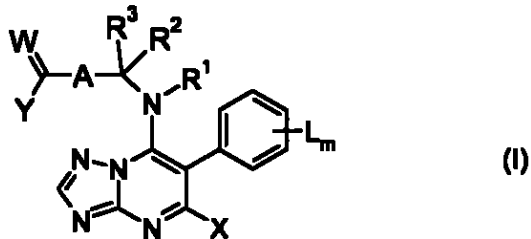
Los compuestos activos se preparan como solución madre, por lo cual 25 mg de compuesto activo se mezcla con una mezcla de acetona y/o DMSO y el emulsionante Uniperol® EL (agente humectante con acción emulsionante y dispersante basada en alquilfenoles etoxilados) en una relación en volumen de solvente : emulsionante de 99 : 1 hasta un volumen total de 10 ml y la dilución de la mezcla hasta un total de 100 ml con agua. Esta solución madre se diluye con la mezcla descrita de solvente-emulsionante-agua hasta la concentración deseada.

Las hojas de semillas germinadas de trigo sembradas del cultivar "Kanzler" se espolvorean con una suspensión de esporas herrumbre pardo (*Puccinia recondita*). Las macetas se colocaron en una cámara con elevada humedad atmosférica (90 a 95%) at 20–22°C durante 24 horas. Durante este tiempo, las esporas germinaron y los tubos germinativos penetraron en el tejido de las hojas. Al día siguiente se rociaron las hojas hasta punto de chorreo con una suspensión acuosa con la concentración de compuesto activo establecida a continuación. Las suspensiones o emulsiones se prepararon como se describió antes. Después de secar la cubierta rociada se cultivaron las plantas de prueba en un invernadero a temperaturas entre 20 y 22°C y a 65 a 70% de humedad relativa durante 7 días. Luego se determinó la extensión del desarrollo de la herrumbre en las hojas.

En esta prueba, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos activos de los ejemplos 60, 61 no mostraron infección, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en un 80%.

REIVINDICACIONES

1. Una triazolopirimidina sustituida caracterizada porque tiene la fórmula I



en donde:

X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₂;

W es oxígeno o azufre;

Y es O-R⁴ o un grupo NR⁵R⁶;

A es un enlace químico o un grupo CR⁷R⁸;

los radicales L independientemente uno de otro son halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro, amino, NHR, NR², ciano, S(=O)_nA¹ o C(=O)A², en donde

R independientemente uno de otro es alquilo C₁-C₈ o alquilcarbonilo C₁-C₆;

A¹ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₈, NH₂, alquilamino C₁-C₈ o di-(alquil C₁-C₈)amino;

n es 0, 1 ó 2;

A² es alquenilo C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, haloalcoxi C₁-C₆, hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, NH₂, alquilamino C₁-C₈ o

di-(alquil C₁-C₆)amino;

m es 0 ó 1, 2, 3, 4 ó 5;

R¹ es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, formilo, alquilcarbonilo C₁-C₄ o alcóxicarbonilo C₁-C₄ o junto con R² es alquileo C₃-C₆ donde un átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C₁-C₄ grupos y/o 1 ó 2 radicales R^a;

R^a: es halógeno, OH, alcoxi C₁-C₄ o alcóxicarbonilo C₁-C₄;

R² es hidrógeno, alquilo C₁-C₆ que tiene un radical R^b, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₂-C₆ o fenilo que opcionalmente lleva 1, 2 ó 3 radicales R^c;

R^b: es OR⁹, SR¹⁰, NR¹¹R¹², COOR¹³, CONR¹⁴R¹⁵, NHC(=NR¹⁶)NR¹⁴R¹⁵, fenilo que opcionalmente lleva 1, 2 ó 3 radicales R^c, heteroarilo de 5 ó 6 miembros que tiene 1 átomo de nitrógeno y opcionalmente 1 ó 2 otros heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en O, S y N como miembros del anillo y que opcionalmente lleva 1 ó 2 radicales R^b o puede portar un anillo fenilo fusionado que por su parte puede tener 1 ó 2 radicales R^b, o es cicloalquilo C₃-C₆;

R^c: es halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, OH, alcoxi C₁-C₄ o alcóxicarbonilo C₁-C₄;

R³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄ o junto con R² es alquileo C₃-C₆ donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C₁-C₄ y/o 1 ó 2 radicales R^a;

188
788

R⁴ es hidrógeno, alquilo C₁-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, hidroxi- alcoxi C₁-C₄- alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₈, alquenilo C₂-C₈, haloalquenilo C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆- alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₈, fenilo, fenilalquilo C₁-C₄, en donde fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede tener 1, 2 ó 3 de los sustituyentes R^d siguientes:

R^d: es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄aminocarbonilo, dialquil C₁-C₄ aminocarbonilo,

o R⁴ junto con uno de los radicales R¹, R², R³ o R⁷ es alquilenilo C₃-C₆ donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 radicales seleccionado del grupo que consiste en halógeno y alquil C₁-C₄ y/o 1 ó 2 radicales R^a;

R⁵, R⁶ independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆- alquilo C₁-C₄, o junto con el átomo de nitrógeno al cual están adosados forman un heterociclo de nitrógeno saturado de 5, 6 ó 7 miembros que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4

86
\\

grupos alquilo C_1-C_4 ;

o uno de los radicales R^5 o R^6 junto con uno de los radicales R^1 , R^2 , R^3 o R^7 es alquileo C_2-C_6 donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a ;

R^7 , R^8 independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 o uno de los radicales R^7 o R^8 junto con uno de los radicales R^1 o R^2 es alquileo C_2-C_6 donde 1 átomo de carbono puede ser reemplazado por un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquilo C_1-C_4 y/o 1 ó 2 radicales R^a ;

R^9 es hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , formilo o alquilcarbonilo C_1-C_8 ;

R^{10} es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^{11} , R^{12} independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 alquilo C_1-C_4 , o junto con el átomo de nitrógeno al cual están adosados forman un heterociclo de nitrógeno saturado de 5, 6 ó 7 miembros que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C_1-C_4 , en donde uno de los radicales R^{11} , R^{12} también puede ser formilo, alquilcarbonilo C_1-C_8 o alquiltiocarbonilo C_1-C_8 ;

R^{13} es hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 ;

alquilo C_1-C_4 , hidroxil- alcoxil C_1-C_4 - alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_8 , alqueno C_2-C_8 , haloalqueno C_2-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_3 - alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalqueno C_3-C_8 , fenilo, fenilalquilo C_1-C_4 , en donde fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede tener 1, 2 ó 3 de los sustituyentes R^d anteriores;

R^{14} , R^{15} independientemente uno de otro son hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 - alquilo C_1-C_4 , o junto con el átomo de nitrógeno al cual están adosados forman un heterociclo de nitrógeno saturado de 5, 6 ó 7 miembros que opcionalmente tiene otro heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N como miembro del anillo y que opcionalmente lleva 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo C_1-C_4 ;

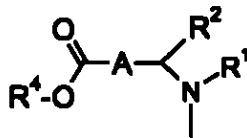
R^{16} es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxil C_1-C_4 ;
o una sal aceptable del compuesto I en agricultura.

2. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado** porque X es halógeno.
3. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, **caracterizado** porque A es un enlace químico.
4. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado** porque Y es un grupo $O-R^4$, en donde R^4 es como se definió antes.
5. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 4, **caracterizado** porque R^4 es alquilo C_1-C_4 o alqueno C_3-C_4 .
6. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las

reivindicaciones anteriores, **caracterizado** porque R^3 es hidrógeno y R^2 es alquilo C_2-C_6 o trifluorometilo o R^1 junto con R^2 es alquileno C_2-C_6 .

7. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizado** porque R^2 es un grupo $(CH_2)_k-R^b$, en donde k es 1 ó 2 y R^b es como se definió antes.

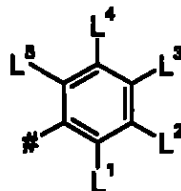
8. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado** porque R^3 es hidrógeno y W es oxígeno, e Y es un grupo OR^4 y, en donde el grupo de la fórmula



deriva de un α -aminoácido o su éster, en donde α -aminoácido es seleccionado del grupo que consiste en prolina, ácido pipecolínico, leucina, isoleucina, metionina, fenilalanina, tirosina y valina.

9. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado** porque m es 1, 2, 3 ó 4 y L es seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y alcoxicarbonilo C_1-C_6 .

10. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 9, **caracterizado** porque el grupo fenilo sustituido por L_m es un grupo de la fórmula



191
192

en donde # es el punto de fijación del esqueleto de triazolopirimidina y

L¹ es flúor, cloro, CH₃ o CF₃;

L², L⁴ independientemente uno de otro son hidrógeno o flúor;

L³ es hidrógeno, flúor, cloro, ciano, CH₃, OCH₃ o COOCH₃; y

L⁵ es hidrógeno, flúor o CH₃.

11. El uso de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores para el control de hongos fitopatógenos.

12. Una composición adecuada para controlar hongos dañinos, caracterizada porque comprende un portador sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.

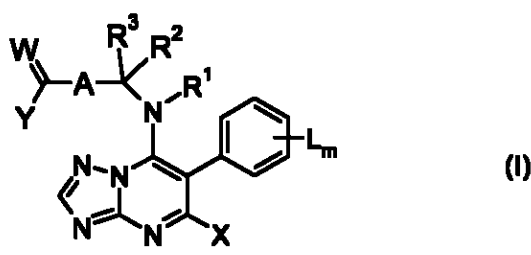
13. Un método para controlar hongos fitopatógenos, caracterizado porque comprende tratar los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas que se protegen contra el ataque de hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.

BUENOS AIRES, JUNIO DE 2005.

RESUMEN

**COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIMIDINA Y SU USO EN EL
CONTROL DE HONGOS DAÑINOS**

Nuevos compuestos de triazolopirimidina de la fórmula I



en donde:

- X es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₂;
- W es oxígeno o azufre;
- Y es O-R⁴ o un grupo NR⁵R⁶;
- A es un enlace químico o un grupo CR⁷R⁸;

y las variables L, R¹ a R⁷ son como se define en la reivindicación 1.

El uso de los compuestos de triazolopirimidina de la fórmula I, sus tautómeros y sus sales aceptables en agricultura para el control de hongos fitopatógenos (= hongos dañinos) y un método para controlar hongos dañinos fitopatógenos, en donde el método comprende tratar el hongo o los materiales, plantas, el suelo o las semillas que se protegen contra el ataque de hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I, un tautómero de I y/o una sal de I de aceptación en agricultura aceptable o su tautómero.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/006855

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 02/50077 A2 (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, GERMANY) 27 June 2002 (2002-06-27) page 4, line 10 - page 13, line 24 examples	1-6, 11-13
Y	WO 03/080615 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTER, CARSTEN; MUE) 2 October 2003 (2003-10-02) cited in the application the whole document	1-13
Y	US 5 994 360 A (PFRENGLE ET AL) 30 November 1999 (1999-11-30) cited in the application the whole document	1-13
	-/-	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- *U* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

12 October 2005

Date of mailing of the international search report

28/10/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. Box 1601, 6000 Luxembourg 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-8040, Tx. 31 881 apo nl,
Fax: (+31-70) 340-8018

Authorized officer

Zellner, A

194
195

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/006855

G.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 8 April 1998 (1998-04-08) cited in the application the whole document	1-13
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INTERNATIONALE RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V) 7 July 1993 (1993-07-07) cited in the application page 1, lines 27-44	1-13
X	WO 02/02563 A2 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORPORATION, USA) 10 January 2002 (2002-01-10) examples 8,241	1-5,8-10
A	WO 02/088127 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, GERMANY) 7 November 2002 (2002-11-07) the whole document	1-13
A	WO 03/080614 A2 (BAYER CROPSCIENCE AG, GERMANY; ET AL.) 2 October 2003 (2003-10-02) the whole document	1-13
A	WO 94/20501 A (SHELL INTERNATIONALE RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V; PEES, KLAUS-JUERGEN; B) 15 September 1994 (1994-09-15) cited in the application the whole document	1-13
A	WO 98/46608 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 22 October 1998 (1998-10-22) cited in the application the whole document	1-13
A	EP 0 071 792 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16 February 1983 (1983-02-16) cited in the application the whole document	1-13

215
796

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2005/006855

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

s e supplemental sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

196
197

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP2005/006855

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely

1. Claims 1-5, 7-13

compounds of formula (I) wherein R^1 is hydrogen, as well as related claims 11-13.

—

2. Claims 1-5, 7-13

compounds of formula (I) wherein R^1 is C_1 - C_4 alkyl, as well as related claims 11-13.

—

3. Claims 1-5, 7-13

compounds of formula (I) wherein R^1 is formyl, as well as related claims 11-13.

—

4. Claims 1-5, 7-13

compounds of formula (I) wherein R^1 is C_1 - C_4 alkylcarbonyl, as well as related claims 11-13.

—

5. Claims 1-5, 7-13

compounds of formula (I) wherein R^1 is C_1 - C_4 alkoxy carbonyl, as well as related claims 11-13.

—

6. Claims 1-5, 7-13

compounds of formula (I) wherein R^1 together with R^2 stands for a C_3 - C_6 alkylene, as well as related claims 11-13.

—

197
198

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/006855

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0250077	A2	27-06-2002	AU 3167602 A	01-07-2002
			DE 10063115 A1	27-06-2002
			EP 1349859 A2	08-10-2003
			JP 2004516296 T	03-06-2004
			US 2004097522 A1	20-05-2004
WO 03080615	A	02-10-2003	AU 2003215664 A1	08-10-2003
			BR 0308529 A	01-02-2005
			CA 2479766 A1	02-10-2003
			CN 1642957 A	20-07-2005
			EP 1490372 A1	29-12-2004
			HR 20040985 A2	31-12-2004
			JP 2005527543 T	15-09-2005
			MA 27198 A1	03-01-2005
US 5994360	A	30-11-1999	NONE	
EP 0834513	A	08-04-1998	AT 221069 T	15-08-2002
			DE 69714171 D1	29-08-2002
			DE 69714171 T2	12-12-2002
			JP 10152489 A	09-06-1998
			US 5965561 A	12-10-1999
			US 5817663 A	06-10-1998
EP 0550113	A	07-07-1993	AT 159256 T	15-11-1997
			AT 192154 T	15-05-2000
			AU 667204 B2	14-03-1996
			AU 3043592 A	01-07-1993
			BR 9205172 A	06-07-1993
			CA 2086404 A1	01-07-1993
			CN 1075144 A	11-08-1993
			CN 1141119 A	29-01-1997
			DE 69222746 D1	20-11-1997
			DE 69222746 T2	12-02-1998
			DE 69230977 D1	31-05-2000
			DE 69230977 T2	09-11-2000
			DK 550113 T3	09-02-1998
			ES 2108727 T3	01-01-1998
			ES 2147411 T3	01-09-2000
			GR 3025920 T3	30-04-1998
			HK 1010105 A1	23-06-2000
			HU 63305 A2	30-08-1993
			IL 104244 A	13-07-1997
			JP 3347170 B2	20-11-2002
			JP 5271234 A	19-10-1993
			NZ 245581 A	26-07-1995
			PL 297160 A1	06-09-1993
			PL 171579 B1	30-05-1997
			PT 782997 T	29-09-2000
			RU 2089552 C1	10-09-1997
			SG 47563 A1	17-04-1998
			ZA 9210043 A	28-07-1993
WO 0202563	A2	10-01-2002	AU 7306201 A	14-01-2002
			BG 107277 A	30-01-2004
			BR 0112038 A	01-04-2003
			CA 2413802 A1	10-01-2002
			CN 1592624 A	09-03-2005

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/006855

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0202563 A2		CZ 20024150 A3 EP 1307200 A2 HU 0300798 A2 JP 2004502691 T MX PA02011913 A NO 20026195 A NZ 523807 A PL 360027 A1 SK 18412002 A3 ZA 200300793 A	17-09-2003 07-05-2003 28-07-2003 29-01-2004 22-04-2003 27-02-2003 24-09-2004 06-09-2004 03-06-2003 20-07-2004
WO 02088127 A	07-11-2002	DE 10121102 A1 EP 1392695 A2 JP 2004534019 T US 2004157863 A1	07-11-2002 03-03-2004 11-11-2004 12-08-2004
WO 03080614 A2	02-10-2003	AU 2003212322 A1 DE 10212886 A1 EP 1490370 A2 US 2005222173 A1	08-10-2003 02-10-2003 29-12-2004 06-10-2005
WO 9420501 A	15-09-1994	AT 159722 T AU 690899 B2 AU 6258094 A BR 9405988 A CA 2157293 A1 CN 1119015 A CZ 9502233 A3 DE 69406538 D1 DK 699200 T3 HK 1004332 A1 HU 73163 A2 IL 108747 A JP 3438892 B2 JP 8507505 T NZ 262729 A PL 310467 A1 RU 2130459 C1 SG 48860 A1 SK 106895 A3 UA 61871 C2 US 5854262 A ZA 9401485 A	15-11-1997 07-05-1998 26-09-1994 26-12-1995 15-09-1994 20-03-1996 17-01-1996 04-12-1997 20-07-1998 20-11-1998 28-06-1996 12-03-1999 18-08-2003 13-08-1996 26-01-1996 11-12-1995 20-05-1999 18-05-1998 05-06-1996 15-12-2003 29-12-1998 10-11-1994
WO 9846608 A	22-10-1998	AT 239727 T AU 735730 B2 AU 6867198 A BG 64197 B1 BG 103805 A BR 9808531 A CA 2287470 A1 CN 1104433 C CZ 9903596 A3 DE 69814375 D1 DE 69814375 T2 DK 975635 T3 EA 2906 B1 EE 9900486 A	15-05-2003 12-07-2001 11-11-1998 30-04-2004 30-06-2000 23-05-2000 22-10-1998 02-04-2003 17-05-2000 12-06-2003 24-12-2003 02-06-2003 31-10-2002 15-06-2000

198
199

200

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/006855

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9846608	A	EP 0975635 A1	02-02-2000
		ES 2199436 T3	16-02-2004
		HU 0001993 A2	28-10-2000
		ID 24182 A	13-07-2000
		IL 132238 A	29-05-2003
		JP 2001520650 T	30-10-2001
		NO 994973 A	13-10-1999
		NZ 500143 A	29-06-2001
		OA 11203 A	21-05-2003
		PL 336164 A1	05-06-2000
		PT 975635 T	30-09-2003
		SK 141499 A3	11-09-2001
		TR 9902552 T2	22-05-2000
		TW 460476 B	21-10-2001
		ZA 9803054 A	11-10-1999
EP 0071792	A	16-02-1983	
		AU 553663 B2	24-07-1986
		AU 8665982 A	10-02-1983
		CA 1180329 A1	01-01-1985
		CS 226748 B2	16-04-1984
		DD 202093 A5	31-08-1983
		DE 3130633 A1	17-02-1983
		DK 341682 A	02-02-1983
		GR 76193 A1	03-08-1984
		HU 188325 B	28-04-1986
		IE 53269 B1	28-09-1988
		JP 1634879 C	20-01-1992
		JP 2061955 B	21-12-1990
		JP 58043974 A	14-03-1983
		US 4567263 A	28-01-1986
		ZA 8205498 A	27-07-1983

Extracto de publicación Folio 200

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Empresas de Tecnología y Servicios

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

202

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-128580-00000-0000
Fec: 2008-12-22 11:33:34 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYII
Evo: 3/8 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION
Folios: 202

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 89,329
FECHA : NOVIEMBRE 21 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CANELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	59936392	21/11/2006	33,115,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO 00361 841 151 0
P. 5027 Ex. 3072

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
 Rad: 06-128580- -00000-0000
 Fee: 2006-12-22 11:33:34 Dep. 2020 NUECREACIONES
 Tra. 11 PATENTEYII
 Eve: 3/8 FASENACIONALI
 Act 411 PRESENTACION Folios: 202

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

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

COMPLETA []

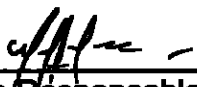
INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []


 Firma/Responsable

Fecha 22 DE DIC 2006

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

204

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Folio 204

2020
Bogotá D.C.,

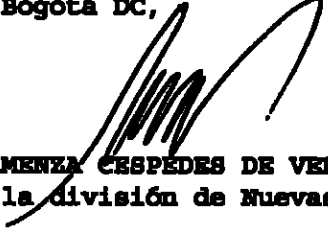
Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	06 128580
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/006855
	Fecha inicio fase nacional	25/01/2007
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	2391
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

31 ENE. 2007


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

adpa10