



Industria y Comercio

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

Delegatura de propiedad Industrial

Division de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-128581

21 EXPEDIENTE No

54 TÍTULO

USO DE 6-(2-TOLIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS COMO FUNGICIDAS

NUEVAS 6-(2-TOLIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS

PARA SU PREPARACION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR

HONGOS NOCIVOS ASI COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN.

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

A01N 43/653

71 SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74 APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C 438 019 de Usaquén

22 BOGOTÁ, D C ,



PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-128581- -00000-0000
Fec: 2006-12-22 11:35:22 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios. 92

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:		
1 ☒ Patente de Invención. ☐ Capítulo I. ☐ Patente de Modelo de Utilidad. ☒ Capítulo II.		
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: BASF AKTIENGESELLSCHAFT sociedad constituida y existente bajo las leyes de: Republica Federal de Alemania Dirección: 67056 Ludwigshafen, República Federal de Alemania Domicilio: Ludwigshafen, República Federal de Alemania	IDENTIFICACIÓN C.C.☐ C.E.☐ NIT☐ 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: <u>clientes@camvp.com.</u> Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C.☒ C.E.☐ NIT☐ Otro☐ Cual _____ Número <u>438.019</u> T.P <u>31.929</u>
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Cartsten BLETTNER Unit. A 4/F, No. 23 Repulse Bay Road Hong Kong, China 2. Markus GEWEHR Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, República Federal de Alemania 3. Wassilios GRAMMENOS Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, República Federal de Alemania 4. Thomas GROTE Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, República Federal de Alemania 5. Udo HÜNGER Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz, República Federal de Alemania 6. Bernd MÜLLER Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, República Federal de Alemania 7. Matthias NIEDENBRÜCK Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof, República Federal de Alemania 10. Frank SCHIEWECK Lindenweg 4, 67258 HeBheim, República Federal de Alemania 11. Anja SCHWÖGLER Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, República Federal de Alemania 12. Oliver WAGNER Im Meisental 50, 67433 Neustadt, República Federal de Alemania 13. Barbara NAVE Burgunderweg 2a, 67146 Deidesheim, República Federal de Alemania 14. Maria SCHERER Hermann-Jürgens-Strasse.30, 76829 Godramstein República Federal de Alemania 15. Siegfried STRATHMANN Donnersbergstrasse. 9, 67117 Limburgerhof República Federal de Alemania 16. Ulrich SCHÖFL Erlenstr. 8, 68782 Brühl, 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/EP2005/006343 Fecha: 14 de Junio de 2005
Publicación Internacional No. WO 2005/123740 A1 Fecha: 29 de Diciembre 2005

6

TITULO (54)

**USO DE 6-(2-TOLIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS COMO FUNGICIDAS. NUEVAS
6-(2-TOLIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN
Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS ASÍ COMO
PRODUCTOS QUE LAS CONTINEN**

7

Clasificación Internacional (51) C07D 487/04

A 01N 43/63

8

PrioridadSI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

DE

(32) Fecha

22 de Junio de 2004

(31) Número de Solicitud

10 2004 030 165.4

9

Comprobante de pago No.: 06 - 94.107**Fecha: 11 de diciembre de 2006**

10

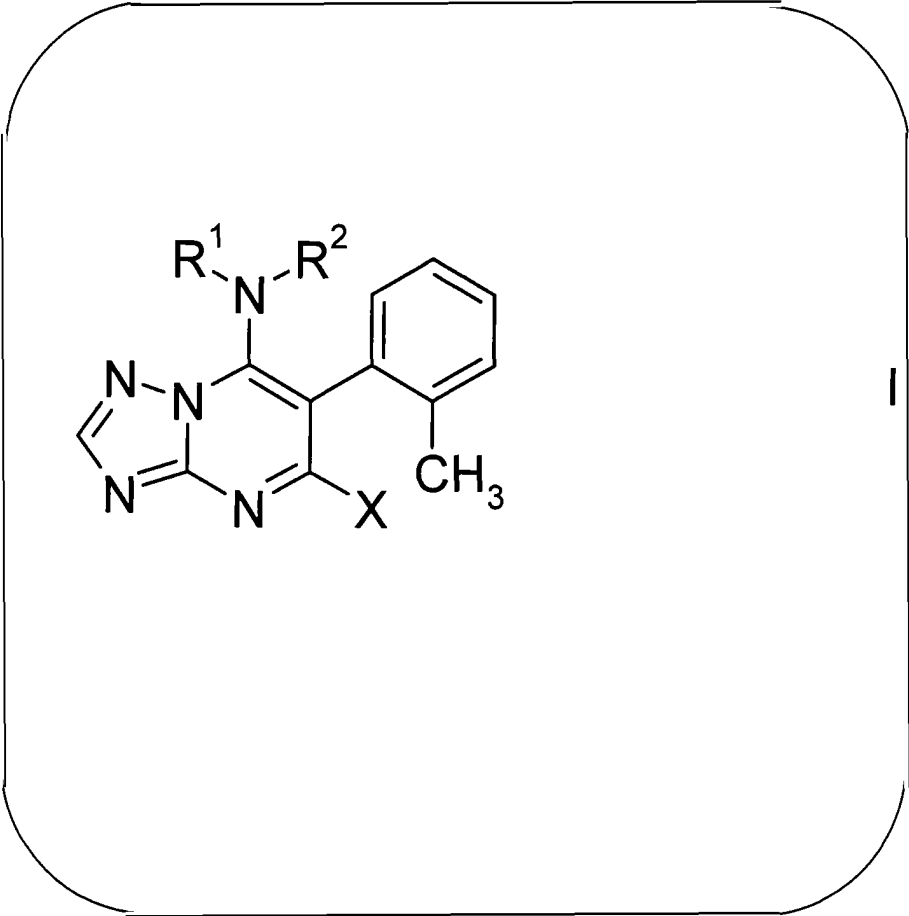
Anexos:

- ☒ 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

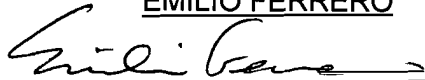
FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA : 

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

320 ZCA

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional

Descripción:

Páginas en el idioma original 19

Páginas en español 27

Reivindicaciones: Número (s) 13

Figuras: Número (s)

2. ☒ Forma PCT/IB/306. **Notificación de Cambio de dirección del inventor Carsten BLETTNER**

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN FASE
INTERNACIONAL**

COLOMBIA

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República

Federal de Alemania

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

Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me(nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y 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, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos hechos por agentes oficiosos.

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

[Firma]
Firma

ppa. Welzel

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

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten 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 Gennanten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters oder der ersten Stellvertreter, zweiten oder dritten Stellvertreter, beziehungsweise, oder einer oder anderen, ordnungsgemäss werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufbruch der 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 zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Sammel-, Defensive- und Service-zeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen und -zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung; Names und Wohnsitzänderung; freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragslizenz; b) Die Oppositionen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmassnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die in diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhaftungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am 17. März 1989

in D-6700 Ludwigshafen

[Unterschrift]
Unterschrift
ppa. Richters

GENERAL DE COI

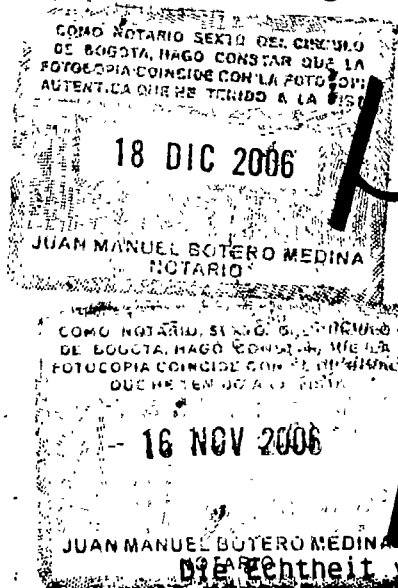
Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorstehend
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren:

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

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

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

Ludwigshafen am Rhein, den 17. März 1989



Th. Walter

als amtl. bestellter Vertreter
des Notars Dr. Kohler

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors
Thomas Walter

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20,-- DM



LUZ ARRIAGA DE HERRERA
17 MAR 1989
1407/89

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

Nº - 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) firma(s) fué
(fueron) autenticada(s) ante el Notario Thomas Walter-----
----- es(son) su(s) representante(s)
te(s) legal(es) en este país.

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

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

Frankfurt a. M 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por 143.60 de los E. G. U. U.



Nº - 0077

Martha Niño de Stand
Cónsul Gen ral d Colombia

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

16 NOV 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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

18 DIC 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES

Bogotá
12 ABR 1989 No. **8506**

del Sr. *Cartha Mino*
cuyo firma aparece en el documento
documento, el cual he tenido a la vista
las funciones de notario

Cartha Mino
BOGOTÁ 12 ABR 1989 ACUÑA
Notario General

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON LA FOTOCOPIA
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA
18 DIC 2006
JUAN MANUEL NOTERO MEDINA
NOTARIO

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

Die konsularische Legalisierung ist notwendig.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según los artículos 85 del C. de P. 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.

LA LEY DE NOTARÍA DE 1991
EXCELENTE QUE TOMOS LOS

SE DEBE ESTAR URGENTE
SE CON ALGUN VALOR

COMO NOTARIO JUNTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCIERDE CON LA ORIGINAL
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA

18 DIC 2005

JUAN MANUEL NOTERO MEDINA
NO. 10

881051599954

B.C.C. 16
SUCURSAL CORPORATIVA

IMPUESTO DE TIMBRE NACIONAL		16 013 01 000045 1 RECIBO DE IMPUESTOS 16 013 01 000045 1	
1 Administración de Impuestos de:		Código	2 Teléfono
BOGOTA		03	2120100
3 Documento de Identificación (marque X)		4 Apellido y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres).	
C.C. o T.I. ☐ NIT. ☒ No.	D.V. ☐	CAVELTER ABOGADOS	
860041367	9		
5 Apellido y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 60 caracteres).		6 Número de documento timbrado.	
C.C. o T.I. ☒ NIT. ☐ No.	D.V. ☐	1	
19301629		FORERO ROCHA JADME	
7 Dirección de la persona o entidad identificada en la casilla 4)		Municipio	Departamento
Cra. 4a. No. 72-35		BOGOTA	CUNDINAMARCA
8 Descripción del acto o contrato (indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción)			
TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1969 PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER COLO 0361-62-218-8			
REVISADO SECCION DE NEGOCIOS GENERALES DE ASUNTOS CONSULARES DE RELACIONES EXTERNAS			

Responsable del pago	
Nombre	
C.C. No.	19301629

FORMA	VALORES	VP	VCE
		VS	VC
		ME	MC
		TP	TC

COMO NOTARIO JUNTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCIERDE CON LA ORIGINAL
AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA

16 NOV 2005

CON PAGO

CONTRIBUYENTE: NOTERO MEDINA
NOTARIO

DEM-91-V-08

9

TRADUCCION OFICIAL NO. 2056

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

COMO NOTARIO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HACGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONFORME CON LA FOTO ORIGINAL AUTENTICA QUE HE TENIDO A LA VISTA
18 OCT 2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

COMO NOTARIO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HACGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONFORME CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
1 NOV 2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

LUZ ARRIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. 599 Minutario

10

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 repre

sentante 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.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE ROGUTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONCINCIE CON LA FOTOCOPIA ORIGINAL QUE SE TENDIA A LA VISTA
18-03-2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE ROGUTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONCINCIE CON LA FOTOCOPIA ORIGINAL QUE SE TENDIA A LA VISTA
16 NOV 2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

LUZ ARRIAGA DE REYES
TRADUCTORA DE INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. 509 Ministreio

El Presidente del Tribunal Regional

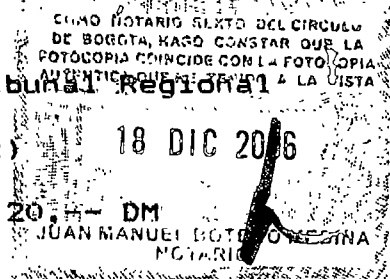
Fdn.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional

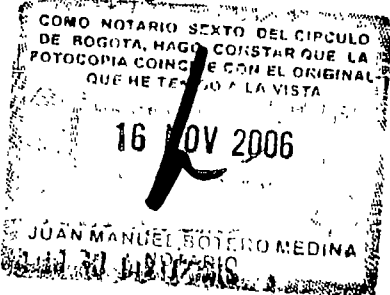
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20. -- DM



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

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

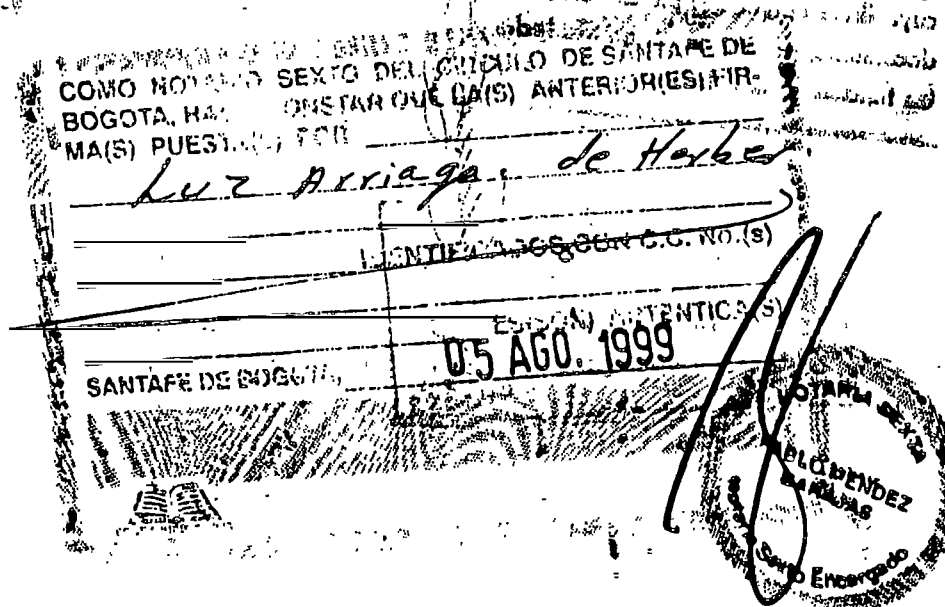


ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Boletín No. 509



COMO
DE BOGOTA
FOTOGRAFIA
AUTENTICADA
18 DIC 2006
JUAN MANUEL LOTERO MEDINA
NOTARIO

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 8 ABR 1989 No. 89045
HACE CONSTAR
Que el señor
LUZ DE HERRERA
cuya firma aparece al pie del presente
documento, desempeñaba en esa fecha
las funciones allí indicadas.

CUMPLIENDO CON EL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCUPIA LUNCIÓ CON EL ORIGINAL
QUE HE VERIFICADO A LA VISTA
16 NOV 2006
JUAN MANUEL LOTERO MEDINA
NOTARIO

Ministerio de Relaciones Exteriores
División Consular
Encargado

ENCARGADO
ENCARGADO
ENCARGADO

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 49, No. 72-35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

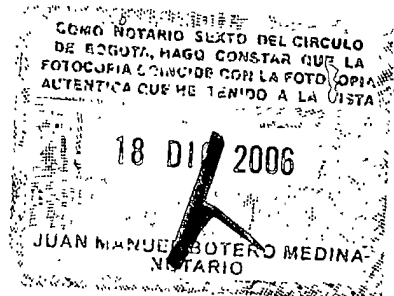
TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLES: CAVELEYES

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

Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

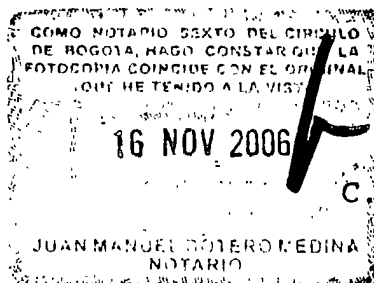
Poder conferido el: 17-03-89



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

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

Señor Jefe,




GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

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-c.mparecio, el Doctor EMILIO FERNANDEZ

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 429.91
expedida en UAGUAY y la tarjeta profesional
número 21.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: P.D. MUÑOZ (Cousin)
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRÁFA 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-c.mparecio, el Doctor Germán

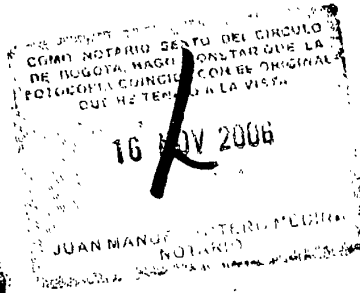
Parra
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 207222
expedida en 26 y la tarjeta profesional
número 632 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRÁFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



0000055681

CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

Carsten Blettner
Richard-Wagner-Str.48, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece
Thomas Grote
Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany
Udo Hüniger
Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz
Germany
Citizen of Germany
Bernd Müller
Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany
Matthias Niedenbrück
Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof
Germany
Citizen of Germany
Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany
Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany
Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

Anja Schwöglér
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany
Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Germany
Citizen of Germany
Barbara Nave
Burgunderweg 2a, 67146 Deidesheim
Germany
Citizen of Austria
Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein
Germany
Citizen of Germany
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Germany
Citizen of Germany
Ulrich Schöfl
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany
Reinhard Stierl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany

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

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

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

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.

© CAVELIER ABOGADOS

WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

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

Use of 6-(2-tolyl)triazolopyrimidines as fungicides, novel
6-(2-tolyl)triazolopyrimidines, processes for their
preparation and their use for controlling harmful fungi, and
composi-tions comprising these compounds

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

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Germany

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

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

Dado y firmado hoy

Given and signed this

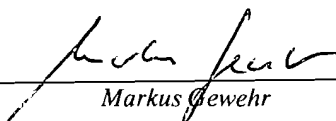
04. Juli 2005

Firma

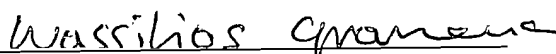
Signature



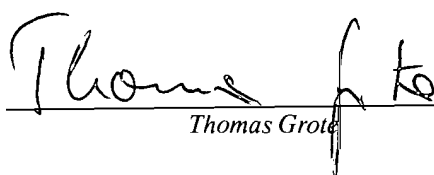
Carsten Blettner



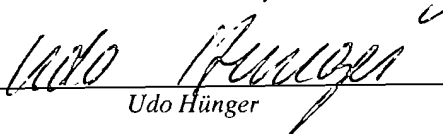
Markus Gwehr



Wassilios Grammenos



Thomas Grote



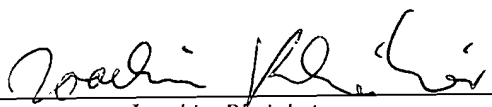
Udo Hüniger



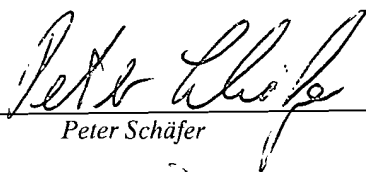
Bernd Müller



Matthias Niedenbrück



Joachim Rheinheimer



Peter Schäfer



Frank Schieweck

Anja Schwoßler

Anja Schwöglér

Oliver Wagner

Oliver Wagner

Barbara Nave

Barbara Nave

Maria Scherer

Maria Scherer

Siegfried Strathmann

Siegfried Strathmann

Ulrich Schöfl

Ulrich Schöfl

Reinhard Stierl

Reinhard Stierl

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS

WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

17

U.R.Nr. 1628/2005

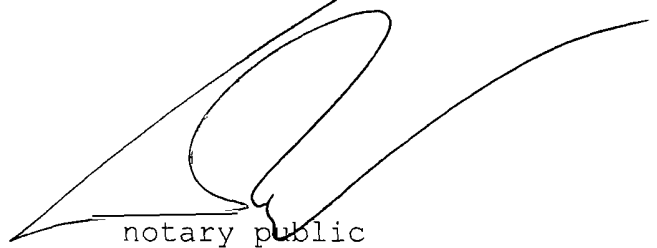
I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at
Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany,
hereby testify and confirm that the foregoing
signatures of

1. Mr. Casten **Blettner**, residing at Richard-
Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Germany,
personally known to me,
2. Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestr. 21,
56288 Kastellaun, Germany, personally known to
me,
3. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-
Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Germany,
Citizen of Greece, personally known to me,
4. Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Höhnhausen 18,
67157 Wachenheim, Germany, personally known to
me,
5. Mr. Udo **Hüniger**, residing at Kurt-Schumacher-
Str. 43, 55124 Mainz, Germany, personally known
to me,
6. Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockinger Str.
7, 67227 Frankenthal, Germany, personally known
to me,
7. Mr. Matthias **Niedenbrück**, residing at Albert-
Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof, Germany,
personally known to me,
8. Mr. Joachim **Rheinheimer**, residing at Merziger
Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Germany,
personally known to me,
9. Mr. Peter **Schäfer**, residing at Römerstr. 1,
67308 Ottersheim, Germany, personally known to
me,

10. Mr. Frank **Schieweck**, residing at Lindenweg 4,
67258 Heßheim, Germany, personally known to
me,
11. Mrs. Anja **Schwögl**er, residing at Heinrich-
Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Germany,
personally known to me,
12. Mr. Oliver **Wagner**, residing at Im Meisental
50, 67433 Neustadt, Germany, personally known
to me,
13. Mrs. Barbara **Nave**, residing at Burgunderweg
2a, 67146 Deidesheim, Germany, Citizen of
Austria, personally known to me,
14. Mrs. Maria **Scherer**, residing at Hermann-
Jürgens-Str. 30, 76829 Godramstein, Germany,
personally known to me,
15. Mr. Siegfried **Strathmann**, residing at
Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof,
Germany, personally known to me,
16. Mr. Ulrich **Schöfl**, residing at Erlenstr. 8,
68782 Brühl, Germany, personally known to me,
17. 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 €

APOSTILLE

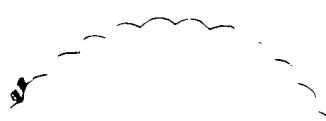
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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,-- €

TRADUCCIÓN OFICIAL 317/2006 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 INVENTORES ABAJO FIRMANTES (VER LA LISTA DE NOMBRES EN LA AUTENTICACIÓN QUE SIGUE) DECLARAMOS BAJO JURAMENTO SER LOS INVENTORES ÚNICOS Y VERDADEROS DE LA INVENCION **USO DE 6-(2-TOLIL)-TRIAZOLOPIRIMIDINAS COMO FUNGICIDAS, NUEVAS 6-(2-TOLIL)-TRI-AZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASÍ COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN.** ADEMÁS QUE CEDEN SIN RESERVAS NI LIMITACIONES EN FAVOR DE **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**, 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 COMPAÑÍA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE EN LA REPÚBLICA DE COLOMBIA. DADO Y FIRMADO POR CARSTEN BLETTNER Y OTROS (VER LOS NOMBRES Y DIRECCIONES EN LAS AUTENTICACIONES QUE SIGUEN) EL 4 DE JULIO DE 2005

U.R. NR. 1628/2005

Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por la presente certifico que las firmas anteriores correspondientes a

1. Casten Blettner, residente en Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim, Alemania, conocido mío personalmente
2. Markus Gewehr, residente en Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Alemania, conocido mío personalmente
3. Wassilios Grammenos, residente en Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, Ciudadano de Grecia, conocido mío personalmente;

4. Thomas Grote, residente en Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, conocido mío personalmente;
5. Udo Hunger, residente en Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz, Alemania, conocido mío personalmente;
6. Bernd Müller, residente en Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, Alemania, conocido mío personalmente;
7. Matthias Niedenbrück, residente en Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof, Alemania, conocido mío personalmente;
8. Joachim Rheinheimer, residente en Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen, Alemania, conocido mío personalmente;
9. Meter Schäfer, residente en Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Alemania, conocido mío personalmente;
10. Frank Schieweck, residente en Lindenweg 4, 67258, Hessheim, Alemania, conocido mío personalmente;
11. Anja Schwogler, residente en Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim, Alemania, conocido mío personalmente;
12. Oliver Wagner, residente en Im Meisental 50, 67433 Neustadt, Alemania, conocido mío personalmente;
13. Barbara Nave, residente en Burgunderweg 2 a, 67146 Deidensheim, Alemania, ciudadana de Austria, conocida mía personalmente;
14. María Scherer, residente en Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Godramstein, Alemania, conocida mía personalmente;
15. Siegfried Strathmann, residente en Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania, conocido mío personalmente;
16. Ulrich Schöfl, residente en Erlenstr. 8, 68782 Bruhl, Alemania, conocido mío personalmente;
17. Reinhard Stierl, residente en Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania, conocido mío personalmente;

son verídicas y válidas

Ludwigshafen/Rhine, 4 de julio de 2005.

Firma ilegible, notario público

Valor: 5.112,92 Euros

APOSTILLA # 91 Eb-830-847/05

COLO-361-841-152-8

WPCL002G ID. 8309

Bogotá, 7 de diciembre de 2006.

Edmundo Caballero N.

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
541328
Edmundo Caballero
COPIA DE LA APOSTILLA EN EL
DOCUMENTO DESEMPENÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS
NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2006 DIC 12 P 1:48
Jefe de Legalizaciones
Bogotá D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HACGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE
Blanca de Leon
Calcedo Aguero
COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTAFE DE BOGOTA, 12 DIC 2006

REPUBLICA DE COLOMBIA
Circulo Notarial Bogota
Notario Sexto
SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

23

TRADUCCION OFICIAL No. 11694

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
Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Alemania
Ciudadano de Alemania
Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Greece
Thomas Grote
Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Udo Hüniger
Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz
Alemania
Ciudadano de Alemania
Bernd Müller
Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal
Alemania
Ciudadano de Alemania
Matthias Niedenbrück
Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof
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

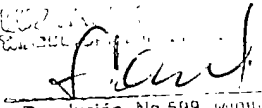

Resolución 599 del 6 de marzo 1978

Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Anja Schwögler
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania
Oliver Wagner
Im Meisental 50, 67433 Neustadt
Alemania
Ciudadano de Alemania
Barbara Nave
Burgunderweg 2a, 67146 Deidesheim
Alemania
Ciudadano de Austria
Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Godramstein
Alemania
Ciudadano de Alemania
Siegfried Strathmann
Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof
Alemania
Ciudadano de Alemania
Ulrich Schöfl
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
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

Uso de 6-(2-tolil)triazolopirimidinas como ungicidas, nuevas 6-(2-tolil)triazolopirimidinas, procedimientos para su preparation y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos , así como productos que las contienen

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, 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


Resolución No 599

los mencionados señores. - Dado y firmado el 04 de julio de 2005 en 67056 Ludwigshafen, Alemania.-

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 bajo U.R. No. 1628 / 2005.- (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

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
541319
COTA FIEL Y COMPLETA
DOCUMENTO DESEMPLEA
LAS DECISIONES INDICADAS

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)

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2006 DIC 19 14:48
JEFE DE LEY
BOGOTÁ
10. Firma legible
Fdo.: firma legible
(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, 08 de diciembre de 2006
C. 2927

Resolución No. 2927
Canales

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

[Handwritten signature]
[Handwritten signature]

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

12 DIC 2006



26

(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
29. Dezember 2005 (29.12.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/123740 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 487/04,
A01N 43/653 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/006343
- (22) Internationales Anmeldedatum:
14. Juni 2005 (14.06.2005)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
10 2004 030 165.4 22. Juni 2004 (22.06.2004) 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). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21,
56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios
[GR/DE]; Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Lud-
wigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhn-
hausen 18, 67157 Wachenheim (DE). HÜNGER, Udo
[DE/DE]; Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz (DE).
MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227
Frankenthal (DE). NIEDENBRÜCK, Matthias [DE/DE];
Albert-Einstein-Allee 3, 67117 Limburgerhof (DE).
RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str.24,
67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE];

Römerstr.1, 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK,
Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE).
SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3,
68165 Mannheim (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE];
Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE). NAVE, Barbara
[AT/DE]; Burgunderweg 2a, 67146 Deidesheim (DE).
SCHERER, Marla [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30,
76829 Godramstein (DE). STRATHMANN, Siegfried
[DE/DE]; Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE).
SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl
(DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251
Freinsheim (DE).

- (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF Aktiengesellschaft;
67056 Ludwigshafen (DE).

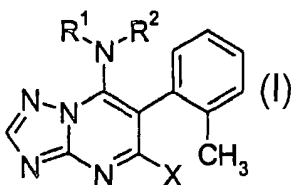
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA,
MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ,
OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC,
VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: USE OF 6-(2-TOLYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINES AS FUNGICIDES, NOVEL 6-(2-TOLYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF, USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI, AND AGENTS CONTAINING THE SAME

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



(57) Abstract: Disclosed is the use of substituted triazolopyrimidines of formula (I), wherein R¹ represents alkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, naphthyl, or a five-membered or six-membered saturated, partially unsaturated, or aromatic heterocycle containing one to four heteroatoms from the group comprising O, N, or S; R² represents hydrogen or a group R¹, R¹ and/or R² being optionally substituted as indicated in the description; and X represents halogen, as fungicides. Also disclosed are novel 6-(2-tolyl)-triazolopyrimidines, a method for producing said compounds, agents containing the same, and the use thereof for controlling plant-pathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von substituierten Triazolopyrimidinen der Formel (I) in der R¹ Alkyl, Cycloalkyl, Halogen-cycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Ha-logencycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, R² Wasserstoff, oder eine Gruppe R¹, wobei R¹ und/oder R² gemäß der Beschreibung substituiert sein können; und X Halogen bedeuten; als Fungizide, neue 6-(2-Tolyl)-triazolopyrimidine, Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

WO 2005/123740 A1

27

WO 2005/123740 A1



TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— mit internationalem Recherchenbericht

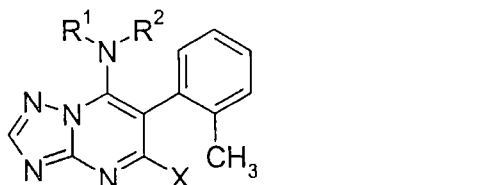
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

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.

Use of 6-(2-tolyl)-triazolopyrimidines as fungicides, novel 6-(2-tolyl)-triazolopyrimidines, method for the production thereof, use thereof for controlling harmful fungi, and agents containing the same

5 Description

The present invention relates to the use of substituted triazolopyrimidines of the formula I



10 in which the substituents are as defined below:

R^1 is C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially
15 unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

R^2 is hydrogen or one of the groups mentioned under R^1 ;

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

R^a is chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkylamino, di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -haloalkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_3 - C_6 -haloalkynyloxy, C_3 - C_6 -cycloalkoxy, C_3 - C_6 -cycloalkenyloxy, oxy- C_1 - C_3 -alkyleneoxy, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to
25 four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
30

where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may carry one to three groups R^b :

35 R^b is chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl,

2

alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxy carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals comprise 1 to 6 carbon atoms and the alkenyl or alkynyl groups mentioned in these radicals comprise 2 to 8 carbon atoms;

and/or one to three of the following radicals:

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclyloxy, where the cyclic systems comprise 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C₁-C₆-alkoxy, aryl-C₁-C₆-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably comprise 6 to 10 ring members and the hetaryl radicals comprise 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups; and

X is halogen;
as fungicides.

Moreover, the invention relates to novel 6-(2-tolyl)triazolopyrimidines, to processes for preparing these compounds, to compositions comprising them and to their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

5-Chloro-6-(2-tolyl)-7-aminotriazolopyrimidines are known in a general manner from EP-A 71 792 and EP-A 550 113. 6-(2-Tolyl)-7-aminotriazolopyrimidines having specific 7-amino groups are disclosed in WO 98/46608. WO 03/008417 proposes 6-(2-tolyl)-7-aminotriazolopyrimidines whose phenyl group carries an additional substituent. It is known that these compounds are suitable for controlling harmful fungi.

Individual 6-(2-tolyl)-7-aminotriazolopyrimidines having pharmaceutical activity are described in WO 02/02563. A fungicidal action of these compounds has not been disclosed.

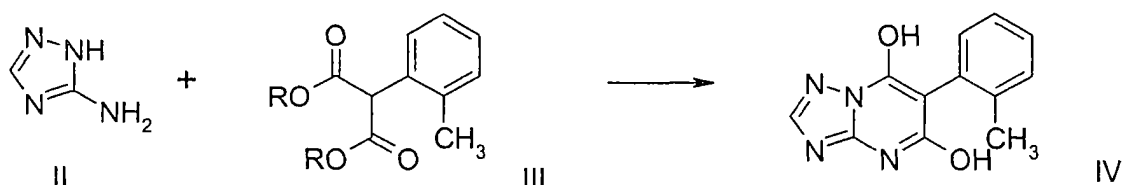
The compounds according to the invention differ from those described in the above-mentioned publications by the properties of the substituents of the 7-amino group and/or by the less complex substitution of the 6-phenyl ring.

However, the fungicidal action of the prior-art compounds is in many cases unsatisfactory. Accordingly, it is an object of the present invention to provide compounds having improved activity and/or a broader activity spectrum.

We have found that this object is achieved by the use, defined at the outset, of compounds of the formula I. Furthermore, we have found novel triazolopyrimidines according to claim 3, processes for their preparation, compositions comprising them and methods for controlling harmful fungi using the compounds I.

The novel compounds according to the invention can be obtained by different routes.

Advantageously, they are prepared by reacting 5-aminotriazole of the formula II with appropriately substituted phenylmalonates of the formula III in which R is alkyl, preferably C₁-C₆-alkyl, in particular methyl or ethyl.



This reaction is usually carried out at temperatures of from 80°C to 250°C, preferably from 120°C to 180°C, in the absence of a solvent or in an inert organic solvent in the presence of a base [cf. EP-A 770 615] or in the presence of acetic acid under the conditions known from Adv. Het. Chem. 57 (1993), 81ff.

Suitable solvents are aliphatic hydrocarbons, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, halogenated hydrocarbons, ethers, nitriles, ketones, alcohols, and also N-methylpyrrolidone, dimethyl sulfoxide, dimethylformamide and dimethylacetamide. The reaction is particularly preferably carried out in the absence of a solvent or in chlorobenzene, xylene, dimethyl sulfoxide or N-methylpyrrolidone. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned.

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

collidine, lutidine and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic amines. Particular preference is given to tertiary amines such as triisopropylethylamine, tributylamine, N-methylmorpholine or N-methylpiperidine.

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

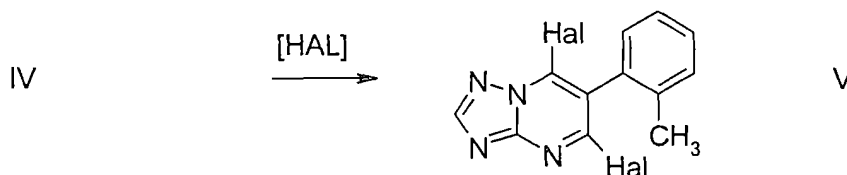
The starting materials are generally reacted with one another in equimolar amounts. In terms of yield, it may be advantageous to employ an excess of base and malonate III, based on the triazole.

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

15

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

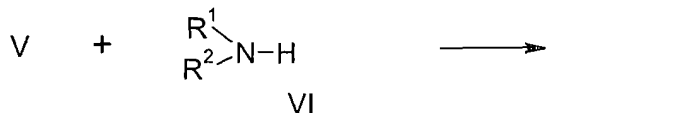
20



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

25

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



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

30

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

such as dichloromethane, or an aromatic hydrocarbon, such as, for example, toluene [cf. WO-A 98/46608].

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

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

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

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

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

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

- 30 alkyl: saturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 1 to 4, 6 or 8 carbon atoms, for example C₁-C₈-alkyl such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl;

- 40 alkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 4, 6 or 8 carbon atoms and one or two double bonds in any position, for example C₂-C₈-

- alkenyl, such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methylethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl, 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- alkynyl: straight-chain or branched hydrocarbon groups having 2 to 4, 6 or 8 carbon atoms and one or two triple bonds in any position, for example C₂-C₆-alkynyl, such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butyne, 2-butyne, 3-butyne, 1-methyl-2-propynyl, 1-pentyne, 2-pentyne, 3-pentyne, 4-pentyne, 1-methyl-2-butyne, 1-methyl-3-butyne, 2-methyl-3-butyne, 3-methyl-1-butyne, 1,1-dimethyl-2-propynyl, 1-ethyl-2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-methyl-2-pentyne, 1-methyl-3-pentyne, 1-methyl-4-pentyne, 2-methyl-3-pentyne, 2-methyl-4-pentyne, 3-methyl-1-pentyne, 3-methyl-4-pentyne, 4-methyl-1-pentyne, 4-methyl-2-pentyne, 1,1-dimethyl-2-butyne, 1,1-dimethyl-3-butyne, 1,2-dimethyl-3-butyne, 2,2-dimethyl-3-butyne, 3,3-dimethyl-1-butyne, 1-ethyl-2-butyne, 1-ethyl-3-butyne, 2-ethyl-3-butyne and 1-ethyl-1-methyl-2-propynyl;
- cycloalkyl: mono- or bicyclic saturated hydrocarbon groups having 3 to 6 or 8 carbon ring members, for example C₃-C₈-cycloalkyl such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl and cyclooctyl;
- five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S:
- 5- or 6-membered heterocyclyl which comprises one to three nitrogen atoms and/or one oxygen or sulfur atom or one or two oxygen and/or sulfur atoms, for

example 2-tetrahydrofuranyl, 3-tetrahydrofuranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-tetrahydrothienyl, 2-pyrrolidinyl, 3-pyrrolidinyl, 3-isoxazolidinyl, 4-isoxazolidinyl, 5-isoxazolidinyl, 3-isothiazolidinyl, 4-isothiazolidinyl, 5-isothiazolidinyl, 3-pyrazolidinyl, 4-pyrazolidinyl, 5-pyrazolidinyl, 2-oxazolidinyl, 4-oxazolidinyl, 5-oxazolidinyl, 2-thiazolidinyl, 4-thiazolidinyl, 5-thiazolidinyl, 2-imidazolidinyl, 4-imidazolidinyl, 2-pyrrolin-2-yl, 2-pyrrolin-3-yl, 3-pyrrolin-2-yl, 3-pyrrolin-3-yl, 2-piperidinyl, 3-piperidinyl, 4-piperidinyl, 1,3-dioxan-5-yl, 2-tetrahydropyranyl, 4-tetrahydropyranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-hexahydropyridazinyl, 4-hexahydropyridazinyl, 2-hexahydropyrimidinyl, 4-hexahydropyrimidinyl, 5-hexahydropyrimidinyl and 2-piperazinyl;

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

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

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

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

Preference is given to compounds of the formula I in which R¹ is not hydrogen.

Particular preference is given to compounds I in which R¹ is C₄-C₈-alkyl or C₄-C₈-alkenyl.

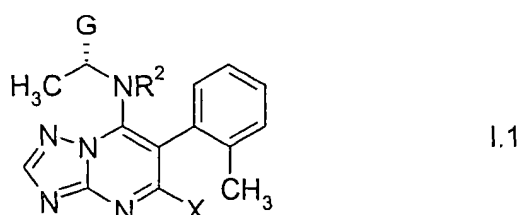
Moreover, preference is given to compounds I in which R¹ is C₃-C₆-cycloalkyl which may be substituted by C₁-C₄-alkyl.

Especially preferred are compounds I in which R^2 is hydrogen.

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

- 5 If R^1 and/or R^2 comprise haloalkyl or haloalkenyl groups having a center of chirality, the (S)-isomers are preferred for these groups. In the case of halogen-free alkyl or alkenyl groups having a center of chirality in R^1 or R^2 , preference is given to the (R)-configured isomers.
- 10 In addition, particular preference is also given to compounds of the formula I in which R^1 is $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, cyclopentyl or cyclohexyl; R^2 is hydrogen or methyl.

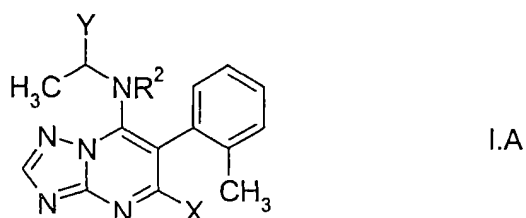
- A preferred embodiment of the invention relates to the use of compounds of the formula I.1:
- 15



in which

- G is $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkyl, in particular ethyl, n- and isopropyl, n-, sec-, tert-butyl, and $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkoxymethyl, in particular ethoxymethyl, or $\text{C}_3\text{-C}_6$ -cycloalkyl, in particular cyclopentyl or cyclohexyl.
- 20

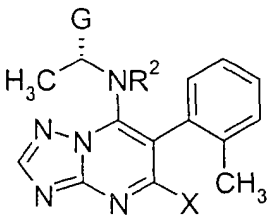
Compounds of the formula I except for compounds of the formula I.A



in which Y is hydrogen or tert-butyl are novel.

- 25 Preference is given to compounds of the formula I in which R^1 is $\text{C}_3\text{-C}_8$ -cycloalkyl, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -halocycloalkyl, $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_8$ -haloalkenyl, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -cycloalkenyl, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -halocycloalkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkynyl, $\text{C}_2\text{-C}_8$ -haloalkynyl or naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to
- 30 four heteroatoms from the group consisting of O, N and S which may be substituted as defined at the outset.

Particular preference is given to compounds of the formula I.1



I.1

5 in which X and R² are as defined in claim 1 and G is ethyl, n- and isopropyl, n- and sec-butyl.

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

Table A
Compounds of the formula I in which X is chlorine

No.	R ¹	R ²
A-1	CH ₃	H
A-2	CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	H
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-7	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-8	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-9	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-10	CH(CH ₃) ₂	H
A-11	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-12	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-16	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-17	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-18	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-19	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-20	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-21	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-22	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-23	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-24	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-28	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-29	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-30	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-31	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-32	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-33	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-37	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-38	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-46	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-47	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-48	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-49	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-50	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-51	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-52	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-53	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-54	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-55	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-56	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-57	CH ₂ -C≡CH	H
A-58	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-59	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-60	Cyclopentyl	H
A-61	Cyclopentyl	CH ₃
A-62	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-63	Cyclohexyl	H
A-64	Cyclohexyl	CH ₃
A-65	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃

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

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

- They are especially suitable for controlling the following plant diseases:
- *Alternaria* species on fruit and vegetables,
 - *Bipolaris* and *Drechslera* species on cereals, rice and lawns,
 - *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
 - *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamental plants and grapevines,
 - *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
 - *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
 - *Mycosphaerella* species on cereals, bananas and peanuts,
 - *Phakopsora pachyrhizi* and *P. Meibomia* on soya,
 - *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
 - *Plasmopara viticola* on grapevines,
 - *Podosphaera leucotricha* on apples,
 - *Pseudocercospora herpotrichoides* on wheat and barley,
 - *Pseudoperonospora* species on hops and cucumbers,

- *Puccinia* species on cereals,
- *Pyricularia oryzae* on rice,
- *Rhizoctonia* species on cotton, rice and lawns,
- *Septoria tritici* and *Stagonospora nodorum* on wheat,
- 5 • *Uncinula necator* on grapevines,
- *Ustilago* species on cereals and sugar cane, and
- *Venturia* species (scab) on apples and pears.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Granules, for example coated granules, impregnated granules and homogeneous granules, can be prepared by binding the active compounds to solid carriers. Examples of solid carriers are mineral earths such as silica gels, silicates, talc, kaolin, attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate,

magnesium sulfate, magnesium oxide, ground synthetic materials, fertilizers, such as, for example, ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, ureas, and products of vegetable origin, such as cereal meal, tree bark meal, wood meal and nutshell meal, cellulose powders and other solid carriers.

5

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

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

A Water-soluble concentrates (SL)

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

15 active compound dissolves upon dilution with water.

B Dispersible concentrates (DC)

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

20 ter gives a dispersion.

C Emulsifiable concentrates (EC)

15 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each

25 case 5%). Dilution with water gives an emulsion.

D Emulsions (EW, EO)

40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each

30 case 5%). This mixture is introduced into water by means of an emulsifying machine (Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion.

E Suspensions (SC, OD)

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

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

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

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

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

2. Products to be applied undiluted

15 H Dustable powders (DP)

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

I Granules (GR, FG, GG, MG)

20 0.5 part by weight of a compound according to the invention is ground finely and associated with 95.5% carriers. Current methods are extrusion, spray-drying or the fluidized bed. This gives granules to be applied undiluted.

J ULV solutions (UL)

25 10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in an organic solvent, for example xylene. This gives a product to be applied undiluted.

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

35

Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions, pastes or oil dispersions, the substances, as such or dissolved in an oil or solvent, can be homogenized in water by means of a wetter, tackifier, dispersant or emulsifier.

40 Alternatively, it is also possible to prepare concentrates composed of active substance,

wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

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

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

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

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

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

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,
- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph,
- 30 fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamine or tridemorph,
- anilinopyrimidines, such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyprodinil,
- antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,
- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole,
- 35 dinitroconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizole or triticonazole,
- dicarboximides, such as iprodione, myclozolin, procymidone or vinclozolin,

- dithiocarbamates, such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram or zineb,
- heterocyclic compounds, such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mandipropamide, mepronil, nuarimol, penthiopyrad, probenazole, proquinazid, pyrifenoxy, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, SYP-Z048 thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole or triforine,
- copper fungicides, such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride or basic copper sulfate,
- nitrophenyl derivatives, such as binapacryl, dinocap, dinobuton or nitrophthal-isopropyl,
- phenylpyrroles, such as fenpiclonil or fludioxonil,
- sulfur,
- other fungicides, such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, diclomezine, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenone, pencycuron, propamocarb, phosphorous acid, phthalide, tolclofos-methyl, quintozone or zoxamide,
- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin (SYP-Z071), fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- sulfenic acid derivatives, such as captan, dichlofluanid, folpet or tolylfluanid,
- cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

Synthesis examples

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

Example 1 – Preparation of 5-chloro-6-(2-methylphenyl)-7-(3-methylbut-2-yl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine

0.2 g (0.72 mmol) of 5,7-dichloro-6-(2-methylphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidine (cf. WO 03/80615), 0.073 g (0.74 mmol) of triethylamine and 0.063 g (0.74 mmol) of 3-

methyl-2-butylamine in 2 ml of dichloromethane were stirred at 20-25°C overnight. The reaction mixture was then washed with dil. HCl solution and water, then dried and freed from the volatile constituents. 0.12 g of the title compound remained as a lightly colored solid of m.p. 110-112°C.

5

Table I

No.	R ¹	R ²	X	phys. data (m.p. [°C])
I-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	114
I-2	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	178
I-3	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	110
I-4	cycloheptyl	H	Cl	137
I-5	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Cl	111
I-6	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	162
I-7	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	140
I-8	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂	Cl	112
I-9	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Cl	141
I-10	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	148
I-11	cyclopentyl	H	Cl	resin
I-12	bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	H	Cl	resin
I-13	CH ₃	H	Cl	resin
I-14	CH ₃	CH ₃	Cl	resin
I-15	CH ₂ CH ₃	H	Cl	resin
I-16	(±) CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	H	Cl	128
I-17	(R) CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	H	Cl	124
I-18	(±) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	110
I-19	(R) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	103
I-20	(±) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	96
I-21	(R) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	95

Examples for the action against harmful fungi

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

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

15 (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkyl-

phenols) was added to this solution, and the mixture was diluted with water to the desired concentration.

Use example 1 – Activity against early blight of tomato caused by *Alternaria solani*

5

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

10

In this test, the plants which had been treated with in each case 250 ppm of the active compounds I-16 to I-21 showed an infection of at most 15%, whereas the untreated plants were 100% infected.

15

Use example 2 – Activity against *Venturia inaequalis* (protective)

Leaves of potted apple seedlings of the cultivar "Common" were sprayed to runoff point with an aqueous preparation of active compound which had been prepared from a stock solution made of 5% of active compound, 94% of acetone and 1% of emulsifier (Tween 20). After the spray coating had dried on (3-5 h), the leaves were inoculated with an aqueous spore suspension of *Venturia inaequalis*. The test plants were then placed in a climatized chamber at 22 - 24°C and 95 - 99% relative atmospheric humidity for 2 days and then cultivated in a greenhouse at 21 - 23°C and about 95% relative atmospheric humidity for a further 2 weeks. The extent of the development of the infection on the leaves was then determined visually.

20

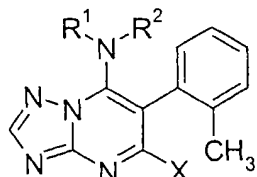
25

In this test, the plants which had been treated with in each case 200 ppm of the compounds I-4, I-5, I-6, I-8, I-9 or I-10 showed an infection of at most 15%, whereas the untreated plants were 90% infected.

30

We claim:

1. The use of triazolopyrimidines of the formula I



I

5 in which the substituents are as defined below:

10 R^1 is C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

R^2 is hydrogen or one of the groups mentioned under R^1 ;

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

20 R^a is chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkylamino, di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -haloalkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_3 - C_6 -haloalkynyloxy, C_3 - C_6 -cycloalkoxy, C_3 - C_6 -cycloalkenyloxy, oxy- C_1 - C_3 -alkyleneoxy, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may carry one to three groups R^b :

30 R^b is chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals comprise 1 to 6 carbon atoms and

21

the alkenyl or alkynyl groups mentioned in these radicals
comprise 2 to 8 carbon atoms;

and/or one to three of the following radicals:

5

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocycloxy, where the
cyclic systems comprise 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy,
arylthio, aryl-C₁-C₆-alkoxy, aryl-C₁-C₆-alkyl, hetaryl, hetaryloxy,
hetarylthio, where the aryl radicals preferably comprise 6 to 10
ring members and the hetaryl radicals comprise 5 or 6 ring
members, where the cyclic systems may be partially or fully
halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups; and

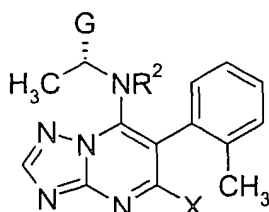
10

X is halogen;

15

as fungicides.

2. The use according to claim 1, wherein the compounds correspond to the formula
I.1:



I.1

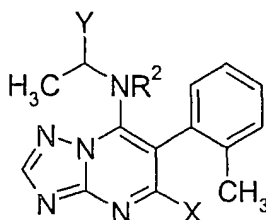
20

in which X and R² are as defined in claim 1 and

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

25

3. A compound of the formula I according to claim 1, except for compounds of the
formula I.A



I.A

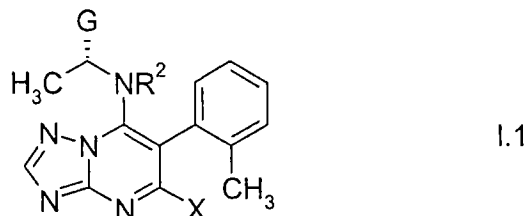
in which Y is hydrogen or tert-butyl.

30

4. The compound of the formula I according to claim 3 in which R¹ is C₃-C₈-
cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₆-cyclo-
alkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl or naphthyl, or a

five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S and may be substituted according to claim 1.

5. The compound of the formula I according to claim 3 or 4 in which X is chlorine.
6. A compound of the formula I.1,

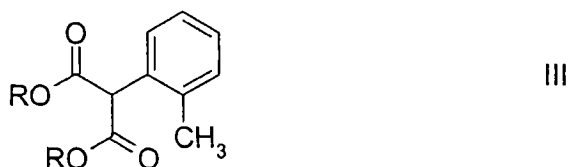


in which X and R² are as defined in claim 1 and G is ethyl, n- and isopropyl, n- and sec-butyl.

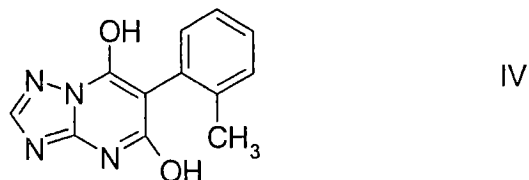
7. A process for preparing compounds of the formula I according to claim 3 by reacting 5-aminotriazole of the formula II



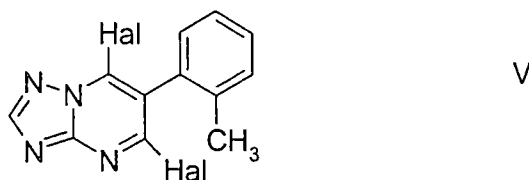
with phenylmalonates of the formula III,



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



halogenation to give the dihalo compounds of the formula V,



and reaction of V with amines of the formula VI



to give compounds of the formula I.

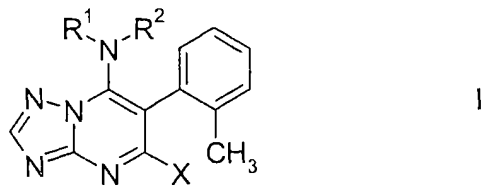
23

8. A fungicidal composition comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to claim 1.
- 5 9. The fungicidal composition according to claim 8 comprising a further fungicidally active compound.
- 10 10. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I according to claim 1.
11. The method according to claim 10 wherein between 0.01 and 2.0 kg of active compound are applied per ha.
- 15 12. The method according to claim 10 wherein from 1 to 1000 g/100 kg of seed are applied.
13. Seed comprising from 1 to 1000 g of a compound of the formula I according to claim 1 per 100 kg.

Use of 6-(2-tolyl)-triazolopyrimidines as fungicides, novel 6-(2-tolyl)-triazolopyrimidines, method for the production thereof, use thereof for controlling harmful fungi, and agents containing the same

5 Abstract

The use of substituted triazolopyrimidines of the formula I

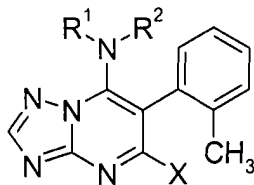


- in which
- 10 R^1 is alkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl or naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle comprising one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- 15 R^2 is hydrogen or a group R^1 , where
- R^1 and/or R^2 may be substituted according to the description, and
- 20 X is halogen;
- as fungicides,
- novel 6-(2-tolyl)triazolopyrimidines, processes for preparing these compounds,
- 25 compositions comprising them and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

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

5 Descripción

La presente invención se refiere al uso de triazolopirimidinas sustituidas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

10

R¹ es C₁-C₈-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

15

R² es hidrógeno o un de los grupos mencionados para R¹;

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

20

R^a es cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-halógenoalquilo, C₁-C₆-alquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-halógenoalcoxi, C₁-C₆-alcoxycarbonilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilamino, di-C₁-C₆-alquilamino, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₆-alqueniloxi, C₃-C₆-halógenoalqueniloxi, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-halógenoalquinilo, C₃-C₆-alquiniloxi, C₃-C₆-halógenoalquiniloxi, C₃-C₆-ciclo-

25

2

alcoxi, C₃-C₆-cicloalqueniloxi, oxi-C₁-C₃-alquilenoxi, naftilo, un heterociclo saturado, parcialmente no saturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

5 pudiendo estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos a su vez llevar uno a tres grupos R^b:

R^b significa cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, conteniendo los grupos alquilo en estos radicales 1 a 6 átomos de carbono y conteniendo los mencionados grupos alquenilo o alquinilo en estos radicales 2 a 8 átomos de carbono;

y/o uno a tres de los siguientes radicales:

20 cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterocicliloxi, conteniendo los sistemas cíclicos 3 a 10 miembros anulares; arilo, ariloxi, ariltio, aril-C₁-C₆-alcoxi, aril-C₁-C₆-alquilo, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, conteniendo los radicales arilo, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetarilo 5 ó 6 miembros anulares, cuyos sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo I haloalquilo; y

X es halógeno;

como fungicidas.

Además, la invención se refiere a nuevas 6-(2-tolil)-triazolopirimidinas, procedimientos
5 para la preparación de estos compuestos, productos que los contienen, así como al uso
de los mismos para combatir hongos fitopatógenos.

De la EP-A 71 792 y EP-A 550 113 se conocen generalmente 5-cloro-6-(2-tolil)-7-amino-
triazolopirimidinas. En la WO 98/46608 se revelan 6-(2-tolil)-7-amino-triazolopirimidinas
10 con grupos 7-amino especiales. En la WO 03/008417 se proponen 6-(2-tolil)-7-amino-
triazolopirimidinas, cuyo grupo fenilo lleva un sustituyente adicional. Estos compuestos
son conocidos para combatir hongos nocivos.

En la WO 02/02563 se describen 6-(2-tolil)-7-amino-triazolopirimidinas con efecto farma-
15 céutico. Un efecto fungicida de estos compuestos no se conoce.

Los compuestos según la invención se distinguen de los compuestos propuestos en las
memorias antes mencionadas en la forma del sustituyente del grupo 7-amino, o bien en la
sustitución menos complicada del anillo 6-fenilo.

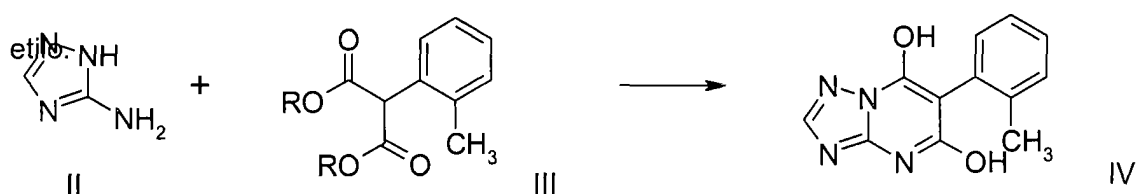
20

Pero el efecto de los compuestos conocidos no es satisfactorio en muchos casos. Par-
tiendo de ello, la presente invención tiene por objeto proveer compuestos con efecto mejo-
rado y/o espectro de acción más amplio.

25 Por tanto, se encontró el uso arriba definido de los compuestos de la fórmula I. Además,
se encontraron nuevas triazolopirimidinas de acuerdo con la reivindicación 3,
procedimientos para su preparación, productos que las contienen, así como un
procedimientos para combatir hongos nocivos usando los compuestos I.

Los compuestos según la invención pueden prepararse mediante diferentes métodos.

Ventajosamente, se preparan por reacción de 5-aminotriazol de la fórmula II con malona-
5 tos de fenilo sustituidos en forma correspondiente de la fórmula III, donde R significa alquilo, preferentemente, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, especialmente metilo o



Esta reacción se realiza, generalmente, a temperaturas de 80°C a 250°C, preferentemen-
10 te, 120°C a 180°C, sin solvente o en un disolvente orgánico inerte, en presencia de una base [ver EP-A 770 615] o en presencia de ácido acético bajo las condiciones conocidas de Adv. Het. Chem. Vol. 57, p. 81 y sig. (1993).

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

20 Como bases son apropiados, generalmente, los compuestos no orgánicos, tales como hidróxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, óxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, e hidruros de metal alcalino y alcalinotérreo, amidas de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, así como los hidrogencarbonatos de metal alcalino, los compuestos de metal orgánicos, especialmente, alquilos de metal alcalino, haluros de alquilmag-
25 nesio, así como los alcoholatos metal alcalino y alcalinotérreo y dimetoximagnesio, además, las bases orgánicas, p.ej. aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, triisopropiletilamina, tributilamina y N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, piridina, piridinas

sustituidas, tales como collidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, así como aminas bicyclicas. Se prefieren, especialmente, las aminas, tales como tri-isopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina o N-metilpiperidina.

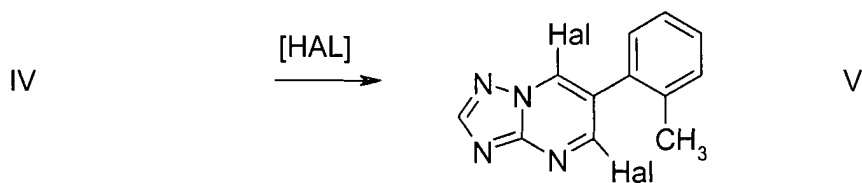
- 5 Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también pueden ser usadas en cantidad equimolar, en exceso o, en caso dado, como disolvente .

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

Malonatos de fenilo de la fórmula III se obtienen, preferentemente, de la reacción de bromobencenos sustituidos en forma correspondiente con malonatos de dialquilo bajo catálisis de Cu(I) [ver Chemistry Letters, p. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

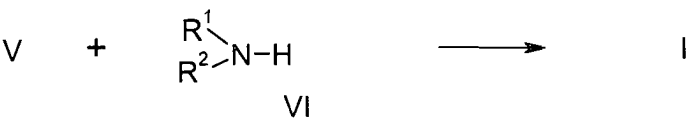
15

Las dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV se transforman bajo las condiciones conocidas de la WO-A 94/en las dihalógenopirimidinas de la fórmula V, donde Hal significa un átomo de halógeno, preferentemente un átomo de bromo o un átomo de cloro, especialmente, un átomo de cloro. Como agente de halogenación [HAL] se usa, ventajosamente,
20 un agente de cloración o un agente de bromación, p.ej. oxibromuro fosfórico o oxiclорuro fosfórico, opcionalmente, en presencia de un disolvente.



Esta reacción se realiza, generalmente, a 0°C a 150°C, preferentemente, a 80°C a 125°C,
25 [ver EP-A 770 615].

Dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula V se transforman ulteriormente con aminas de la fórmula VI,



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

Esta reacción se realiza, ventajosamente, a 0°C a 70°C, preferentemente, 10°C a 35°C, ventajosamente, en presencia de un disolvente inerte, como p.ej. un éter, p.ej. dioxano, éter dietílico o, especialmente, tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano y hidrocarburos aromáticos, como p.ej. tolueno [ver WO-A 98/46608].

Se prefiere usar una base, p.ej, una amina terciaria, como p.ej. trietilamina o aminas no orgánicas, tal como carbonato de potasio; también la amina excesiva de la fórmula VI puede servir de base.

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

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

Si en la síntesis se obtienen mezclas isómeras, generalmente, no es necesario separarlas, ya que los diferentes isómeros pueden convertirse, en parte, durante la preparación

para la aplicación o en la aplicación (p.ej. bajo la acción de la luz o de ácidos o bases) el uno en el otro. Conversiones correspondientes pueden tener lugar también en la aplicación, por ejemplo, en la planta misma o en el hongo nocivo a combatir cuando estos son tratados.

5

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

halógeno: flúor, cloro, bromo e yodo, especialmente, cloro;

10

alquilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales saturados con 1 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono, p.ej. C₁-C₆-alquilo, tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

15

alquenilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales no saturados con 2 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono y un doble enlace en una posición arbitraria, p.ej.. C₂-C₆-alquenilo, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-

20

25

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;

10 alquino: grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono y un triple enlace en una posición arbitraria, p.ej. C_2-C_6 -alquino, tales como etino, 1-propino, 2-propino, 1-butino, 2-butino, 3-butino, 1-metil-2-propino, 1-pentino, 2-pentino, 3-pentino, 4-pentino, 1-metil-2-butino, 1-metil-3-butino, 2-metil-3-butino, 3-metil-1-butino, 1,1-dimetil-2-propino, 1-etil-2-propino, 1-hexino, 2-hexino, 3-hexino, 4-hexino, 5-hexino, 1-metil-2-pentino, 1-metil-3-pentino, 1-metil-4-pentino, 2-metil-3-pentino, 2-metil-4-pentino, 3-metil-1-pentino, 3-metil-4-pentino, 4-metil-1-pentino, 4-metil-2-pentino, 1,1-dimetil-2-butino, 1,1-dimetil-3-butino, 1,2-dimetil-3-butino, 2,2-dimetil-3-butino, 3,3-dimetil-1-butino, 1-etil-2-butino, 1-etil-3-butino, 2-etil-3-butino y 1-etil-1-metil-2-propino;

20

cicloalquilo: grupos hidrocarburo mono o bicíclicos saturados con 3 a 6 ó 8 miembros anulares de carbono, p.ej. C_3-C_8 -cicloalquilo, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo;

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

heterociclilo de cinco o seis miembros, que contiene uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, p.ej. 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridacinilo, 4-hexahidropiridacinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo y 2-piperacinilo;

heteroarilo de cinco miembros, que contiene uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno: grupos heteroarilo pentacíclicos, que además de átomos de carbono uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros anulares, p.ej. 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;

heteroarilo de seis miembros, que contiene uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo hexacíclicos, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres o bien uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros anulares, p.ej. 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridacinilo, 4-piridacinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-piracinilo;

25

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

Las variantes especialmente preferidas de los productos intermedios con respecto a las variables corresponden a aquellas de los radicales L y R^3 de la fórmula I.

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

Se prefieren los compuestos de la fórmula I, en los que R^1 no significa hidrógeno.

10 Se prefieren, especialmente, los compuestos I, en los que R^1 significa C_4 - C_8 -alquilo o C_4 - C_8 -alquenilo.

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

15

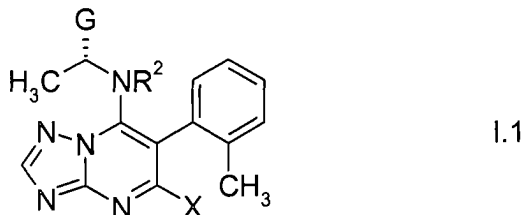
Se prefieren, especialmente, los compuestos I, en los que R^2 significa hidrógeno.

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

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

25 Además, son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, en los que R^1 significa $CH(CH_3)-CH_2CH_3$, $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$, $CH(CH_3)-C(CH_3)_3$, $CH_2C(CH_3)=CH_2$, $CH_2CH=CH_2$, ciclopentilo o ciclohexilo; R^2 significa hidrógeno o metilo.

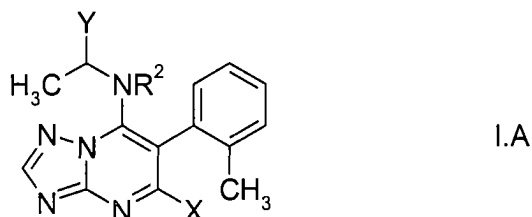
Una variante preferida de la invención se refiere al uso de compuestos de la fórmula I.1:



en la que

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

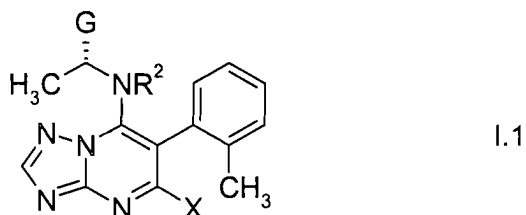
Los compuestos de la fórmula I, con excepción de los compuestos de la fórmula I.A



- 10 donde Y significa hidrógeno o terc.-butilo, son nuevos.

- Son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde R¹ significa C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S, que puede estar sustituido en la forma indicada al comienzo.
- 15

Son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I.1



donde X y R² tienen las definiciones indicadas en la reivindicación 1 y G represente etilo, n- e iso-propilo, n- y sec- butilo.

Con respecto a su uso son especialmente preferidos los compuestos I resumidos en las

5 Tablas siguientes. Los grupos mencionados en las Tablas para un sustituyente representan, además, por si solos, independientemente de la combinación en que son mencionados, una variante especialmente preferida del respectivo sustituyente.

Tabla A

10 Compuestos de la fórmula I, donde X representa cloro.

No.	R ¹	R ²
A-1	CH ₃	H
A-2	CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	H
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-7	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-8	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-9	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-10	CH(CH ₃) ₂	H
A-11	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-12	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-16	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-17	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-18	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-19	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-20	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-21	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-22	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-23	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-24	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H

No.	R ¹	R ²
A-28	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-29	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-30	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-31	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-32	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-33	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-37	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-38	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-46	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-47	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-48	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-49	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-50	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-51	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-52	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-53	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-54	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-55	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-56	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-57	CH ₂ -C≡CH	H
A-58	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-59	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-60	ciclopentilo	H
A-61	ciclopentilo	CH ₃
A-62	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃
A-63	ciclohexilo	H
A-64	ciclohexilo	CH ₃
A-65	ciclohexilo	CH ₂ CH ₃

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

de los *ascomicetos*, *deuteromicetos*, *oomicetos* y *basidiomicetos*. En parte son sistémicamente activos y pueden ser usados en la protección de plantas como fungicidas foliares y del suelo.

- 5 Son especialmente importantes para combatir múltiples hongos en diferentes plantas de cultivo, tales como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, plátanos, algodón, soya, café, caña de azúcar, vid, frutas y plantas de adorno y legumbres, tales como frijoles, tomates y cucurbitáceas, así como en las semillas de estas plantas.
- 10 Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:
 - especies de *Alternaria* en legumbres y frutas,
 - especies de *Bipolaris* y de *Drechslera* en cereales, arroz y césped,
 - *Blumeria graminis* (oídio) en cereales,
 - *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, plantas de adorno y vid,
- 15
 - *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
 - especies de *Fusarium* y de *Verticillium* en diferentes plantas,
 - especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
 - *Phakopsora pachyrhizi* y *P. meibomia* en soja,
 - *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- 20
 - *Plasmopara viticola* en vid,
 - *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
 - *Pseudocercospora herpotrichoides* en trigo y cebada,
 - especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
 - especies de *Puccinia* en cereales,
- 25
 - *Pyricularia oryzae* en arroz,
 - especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz y césped,
 - *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
 - *Uncinula necator* en vid,

- especies de *Ustilago* en cereales y caña de azúcar, así como
- especies de *Venturia* (roña) en manzanas y peras.

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

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

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

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

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

15

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

En el tratamiento de las semillas, las cantidades de ingrediente activo varían, generalmente, de 1 a 1000 g/100 kg de semillas, preferentemente, 1 a 200 g/100 kg, especialmente, 5

20 a 100 g/100 kg.

En la protección de materiales o de productos almacenados, la cantidad de aplicación de ingrediente activo depende de la naturaleza de la aplicación y del efecto deseado. Las

25 cantidades de aplicación generalmente usados para la protección de materiales varían, por ejemplo, de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, 0,005 g a 1 kg de ingrediente activo por metro cúbico del material tratado.

65
3

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

5

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

10

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

20

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

25

y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfíticas y metilcelulosa.

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

- Polvos, agentes de pulverización y rociado pueden ser preparados mezclando o moliendo 15 conjuntamente las sustancias activas con un soporte sólido.

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

25

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

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

A) Concentrados solubles en agua (SL)

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

B) Concentrados dispersables (DC)

10

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

15 C) Concentrados emulsionables (EC)

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

20

D) Emulsiones (EW, EO)

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

E) Suspensiones (SC, OD)

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

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

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

15

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

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

20

2. Productos para la aplicación directa

H) Polvos pulverizables (DP)

25

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

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

0,5 partes en peso de los principios activos son molidos finamente y asociados con 95.5% de soporte. Métodos actuales son: extrusión, secado por pulverización y lecho fluidizado.

- 5 Se obtienen granulados que pueden ser aplicados sin dilución.

J) Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

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

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

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

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

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

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

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

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

- acilalaninas, tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo,
- derivados de amina, tales como aldimorf, dodine, dodemorf, fenpropimorf,
- 25 fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf,
- anilino pirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirima o ciprodinilo,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomicina,

84

- azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloroaz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, trifulmizol,
- 5 triticonazol,
- dicarboximidas, tales como iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,
- ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, benomilo, boscalida, carbendazim,
- 10 carboxina, oxicarboxima, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mandipromadia, mepronilo, nuarimol, pentiopirad, probenazol, proquinazida, pirifenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, SYP-Z048, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina,
- 15 • fungicidas de cobre, tales como caldo de burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacrilо, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- fenilpirroles, tales como fenpiconilo o fludioxonilo,
- 20 • azufre
- otros fungicidas, tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, cloro-talonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, ferimzona, fluacinam, fosetilo, fo-setilo aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, mandipropamida, metrafenona, penci-curona, propamocarb, ácido fosforoso, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida,
- 25 • estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestrobilurina (SYP-Z071), fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobinа, orisastrobina picostrobinа, piraclostrobina o trifloxistrobina,

75

PF 55681

24

- derivados de ácido sulfénico, tales como captafol, captán, diclofluanida, folpet, tolilfluanida
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

5

Ejemplos de síntesis

Las prescripciones indicadas en los siguientes ejemplos de síntesis se pueden usar, variando en forma correspondiente los compuestos de partida, para la generación de otros compuestos I. Los compuestos así obtenidos se indican en las siguientes Tablas con sus datos físicos.

Ejemplo 1 – Preparación de 5-cloro-6-(2-metil-fenil)-7-(3-metilbut-2-il)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina

10

0,2 g (0,72 mmol) de 5,7-dicloro-6-(2-metil-fenil)-1,2,4-triazolo[1,5a]pirimidina (ver WO 03/80615), 0,073 g (0,74 mmol) de trietilamina y 0,063 g (0,74 mmol) de 3-metil-2-butilamina en 2 ml diclorometano se agitaron durante la noche a 20-25°C. A continuación, se lavó la mezcla de reacción con solución diluida de HC y agua, luego se seca y se libra de los componentes volátiles. Quedan 0,12 g del compuesto indicaci en el título como sólidos claros de p.f. 110-112°C.

15

Tabla I

No.	R ¹	R ²	X	Datos físicos (p.f. [°C])
I-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	114
I-2	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	178
I-3	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	110
I-4	cicloheptilo	H	Cl	137
I-5	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Cl	111
I-6	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	162
I-7	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	140
I-8	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂	Cl	112
I-9	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Cl	141
I-10	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	148
I-11	ciclopentilo	H	Cl	Harz
I-12	biciclo[2,2,1]hept-2-ilo	H	Cl	Harz
I-13	CH ₃	H	Cl	Harz
I-14	CH ₃	CH ₃	Cl	Harz
I-15	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Harz

No.	R ¹	R ²	X	Datos físicos (p.f. [°C])
I-16	(±) CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	H	Cl	128
I-17	(R) CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	H	Cl	124
I-18	(±) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	110
I-19	(R) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	103
I-20	(±) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	96
I-21	(R) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	95

Ejemplos del efecto contra hongos nocivos

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

5 ensayos siguientes:

Los ingredientes activos se prepararon separadamente o conjuntamente como solución madre con 0,25% en peso de ingrediente activo en acetona DMSO. A esta solución se adicionó 1% en peso del emulsionante Uniperol® EL (humectante con efecto emulsionante y dispersante basado en alquilfenoles etoxilados) y se diluyó con agua a la concentración deseada.

Ejemplo de aplicación 1 - Eficiencia contra la marchitez temprana del tomate causada por *Alternaria solani*

15

Las hojas de plantas crecidas en macetas de la variedad "Goldene Prinzessin" se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa en la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani* en solución al 2 % de biomalta con una densidad de 0,17 x 10⁶ esporas/ml. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 20 y 22°C. Después de 5 días se había desarrollado la enfermedad tan fuertemente en las plantas de control infectadas pero no tratadas, que la infestación pudo ser determinada visualmente en por cien.

20

En este ensayo, las plantas tratadas con cada vez 250 ppm de los compuestos I-16 a I-21 presentaban una infección de, como máximo, un 15 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta el 100 %.

5

Ejemplo de aplicación 2 – Eficiencia contra *Venturia inaequalis* (aplicación protectora)

Las hojas de plántulas de manzanas de la variedad "Common" crecidas en macetas se pulverizaron hasta chorrear con una preparación acuosa de ingrediente activo, preparada

10 con una solución madre de 5 % de ingrediente activo, 94 % de acetona y 1% de emulsionante (Tween 20). Después de estar seca la capa pulverizada (3-5 h) se inocularon las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Venturia inaequalis*. A continuación, se colocaron las plantas de ensayo para dos días en cámaras climáticas a 22 - 24°C y 95 - 99 % de humedad relativa del aire y entonces se cultivaron otras dos semanas en el

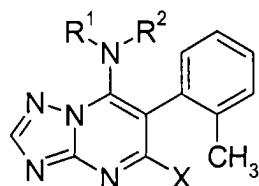
15 invernadero a 21 - 23°C y aprox. 95 % de humedad relativa del aire. Luego se determinó visualmente la extensión del desarrollo de la infección sobre las hojas.

En este ensayo, las plantas tratadas con cada vez 200 ppm de los compuestos I-4, I-5, I-6, I-8, I-9, o bien I-10 presentaban una infestación de, como máximo, un 15 %, mientras

20 que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90 %.

Reivindicaciones

1. Uso de triazolopirimidinas de la fórmula I



I

en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹ significa C₁-C₈-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

R² es hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R¹;

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

R^a significa cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-halógenoalcoxi, C₁-C₆-alcoxycarbonilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilamino, di-C₁-C₆-alquilamino, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₆-alqueniloxi, C₃-C₆-halógenoalqueniloxi, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-halógenoalquinilo, C₃-C₆-alquiniloxi, C₃-C₆-halógenoalquiniloxi, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalqueniloxi, oxi-C₁-C₃-alquilenoxi, naftilo, un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

pudiendo estos grupos alifáticos, alicíclicos o aromáticos a su vez llevar uno a tres grupos R^b:

5 R^b significa cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxi, halógenoalcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, formilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoxilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, conteniendo los grupos alquilo en estos radicales 1 a 6 átomos de carbono y conteniendo los mencionados grupos alquenilo o alquinilo en estos radicales 2 a 8 átomos de carbono;

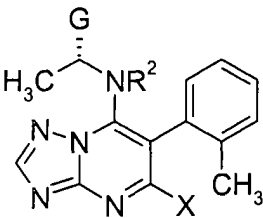
y/o uno a tres de los siguientes radicales:

15 cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterocicliloxi, conteniendo los sistemas cíclicos 3 a 10 miembros anulares; arilo, ariloxi, ariltio, aril-C₁-C₆-alcoxi, aril-C₁-C₆-alquilo, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, conteniendo los radicales arilo, preferentemente, 6 a 10 miembros anulares, los radicales hetarilo 5 ó 6 miembros anulares, cuyos sistemas cíclicos pueden estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo l haloalquilo; y

25 X es halógeno;

como fungicidas.

2. Uso según la reivindicación 1, en donde los compuestos corresponden a la fórmula I.1:

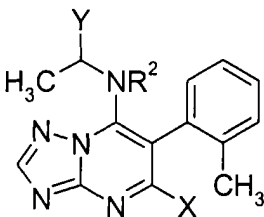


I.1

en la que X y R² tienen las definiciones según la reivindicación 1 y

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

3. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, estando excluidos los compuestos de la fórmula I.A



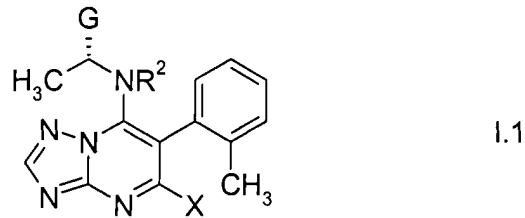
I.A

donde Y significa hidrógeno o terc- butilo.

4. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 3, donde R¹ significa C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S y que puede estar sustituido según la reivindicación 1.

5. Compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 3 ó 4, donde X significa cloro.

6. Compuestos de la fórmula I.1,



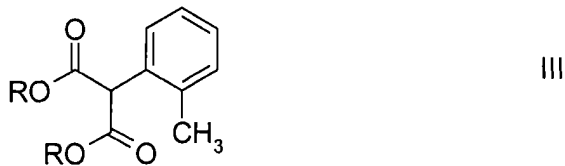
en la que X y R² tienen las definiciones según la reivindicación 1 y G significa etilo, n- e iso-propilo, n- y sec- butilo.

5

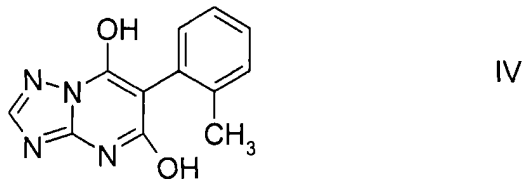
7. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 3, por reacción de 5-aminotriazol de la fórmula II



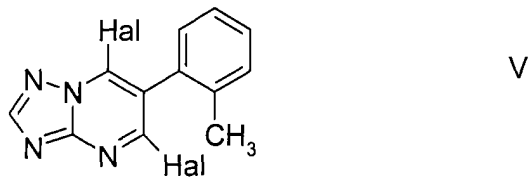
10 con malonatos de fenilo de la fórmula III,



en la que R significa alquilo, dando dihidroxitriazolopirimidinas de la fórmula IV,



halogenación dando compuestos de dihalógeno de la fórmula V,



15

y transformación de V con aminas de la fórmula VI



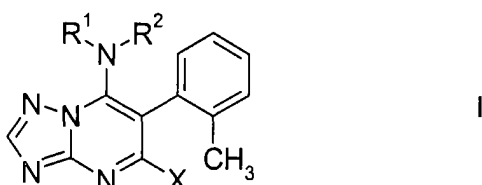
dando compuestos de la fórmula I.

8. Producto fungicida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.
9. Producto fungicida según la reivindicación 8, que contiene otro ingrediente activo fungicida.
10. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, suelos o semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.
11. Procedimiento según la reivindicación 10, caracterizado porque se aplican 0,01 y 2,0 kg de ingrediente activo por ha.
12. Procedimiento según la reivindicación 10, caracterizado porque se aplican 1 a 1000 g/100 kg de semillas.
13. Semillas, que contienen 1 a 1000 g de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1 por 100 kg.

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

5 Resumen

Uso de triazolopirimidinas sustituidas de la fórmula I



en la que

10

R¹ significa alquilo, cicloalquilo, halógenocicloalquilo, alquenilo, halógenoalquenilo, cicloalquenilo, halógenocicloalquenilo, alquinilo, halógenoalquinilo o naftilo, o un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

15

R² es hidrógeno, o un grupo R¹,

pudiendo R¹ y/o R² estar sustituidos en la forma indicada en la descripción; y

20 X es halógeno;

como fungicidas,

nuevas 6-(2-tolil)-triazolopirimidinas, procedimientos para la preparación de estos com-
25 puestos, productos que los contienen, así como su uso para combatir hongos nocivos fitopatógenos.

85

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

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

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055681	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/006343	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.06.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 22.06.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04 A01N43/653		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 4 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☐ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um ☐ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).		
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Berichts ☐ Feld Nr. II Priorität ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☒ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 21.04.2006	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 12.09.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Herz, Claus Tel. +49 89 2399-8275	

36

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/006343

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

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

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

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

Beschreibung, Seiten

1-20 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-13 in der ursprünglich eingereichten Fassung

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

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

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

87

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/006343

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

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-13
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche 1-13
	Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 1-13
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)

und / oder

2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

siehe Beiblatt

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
BERICHT ZUR PATENTIERBARKEIT
(BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/006343

1. Das Prioritätsdokument zur vorliegenden Anmeldung stand am Tage der Abfassung dieses vorläufigen Berichtes nicht zur Verfügung. Dieser gründet sich somit auf die Annahme, daß alle Ansprüche die Prioritätsrechte aus dem Anmeldetag des Prioritätsdokuments genießen. Sollte sich später herausstellen, daß dies unzutreffend ist, wären die Dokumente D1: WO2004/087706 und D2: WO2004/087705 nach Art. 32 (1) PCT in Betracht zu ziehen.

2. Aufgrund der unveränderlichen Anwesenheit eines nicht weiter substituierten 2-Methylphenylrests in 6-Stellung und der Abwesenheit einer Fluoralkylaminogruppe in 7-Stellung werden die beanspruchten Triazolopyrimidine gegenüber dem durch die Dokumente D3 und D4 ausgewiesenen nächstkommenden Stand der Technik als neu erachtet [Art. 33 (2) PCT].

Im Hinblick auf die Ergebnisse der mit Eingabe vom 21/04/06 vorgelegten Vergleichsversuche, welche für die beanspruchten Verbindungen gegenüber diesem Stand der Technik eine überraschende, signifikant erhöhte fungizide Aktivität glaubhaft machen, wird ihre Bereitstellung als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend angesehen [Art. 33 (3) PCT].

89

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)From the INTERNATIONAL BUREAU
of Intellectual Property

To:

02. Juni 2006

BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen
Germany

REF 530

Date of mailing (day/month/year) 24 May 2006 (24.05.2006)		IMPORTANT NOTIFICATION	
Applicant's or agent's file reference 0000055681			
International application No. PCT/EP2005/006343 ✓		International filing date (day/month/year) 14 June 2005 (14.06.2005)	
1. The following indications appeared on record concerning: ☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative			
Name and Address BLETTNER, Carsten Richard-Wagner-Str.48 68165 Mannheim Germany		State of Nationality DE	State of Residence DE
		Telephone No.	
		Facsimile No.	
		Teleprinter No.	
2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning: ☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residence			
Name and Address BLETTNER, Carsten Unit A, 4/F, No. 23 Repulse Bay Road Hong Kong Hong Kong, China		State of Nationality DE	State of Residence CN
		Telephone No.	
		Facsimile No.	
		Teleprinter No.	
3. Further observations, if necessary:			
4. A copy of this notification has been sent to: ☒ the receiving Office ☒ the designated Offices concerned ☐ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned ☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:			
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. (41-22) 338.89.70		Authorized officer Javier CALDERON (Fax 338 8970) Telephone No. (41-22) 338 8567	

SSP

Refiro folio 90 extracto.

90

		FORMATO DE DIGITALIZACION RELACION DE ANEXOS		 Royal Technologies S.A. Microfilm Control Management & RPA	
		Expediente No	06128581	No de Folia	
			No de Unidades	√	
1	1				
2	1				
3	1	A			
4	1				
5	1				
6	1				
7	1				
8	1				
9	1				
10	1	MANILA			
11	1	NCO TAMANO CARTA	✓	h	
12	1	NCC TAMANO OFICIO			
13	1				
Ob	1	Sobre con Arde Fincil			

92
a1

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-128581- -00000-0000
Fec: 2006-12-22 11:35:22 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 3/9 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios. 92

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 94,107
FECHA : DICIEMBRE 11 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55767475	11/12/2006	25,475,000.00

***** 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. _____

6060 00361 841 1523

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

PATENTE DE INVENCION



MODELO DE UTILIDAD []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha 22 de Dic 2008

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

93

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

23

Folio 94

2020
Bogotá D.C.,

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

REFERENCIA	Radicación No.	06 128581
	Solicitud internacional	
	Fecha inicio fase nacional	
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	2583
	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,

15 FEB. 2007

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

lerazo