



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

0734299

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

6-FENIL-7-AMINO-TRIAZOLOPIRIMIDINAS, PROCEDIMIENTOS

PARA SU PREPARACION Y EL USO DE LAS MISMAS PARA

COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS

QUE CONTIENEN LAS MISMAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

RAD: 07-034299- -00000-0000
Fec. 2007-04-04 16:44:39 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTE II
EVE: 375 -ASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios: 251

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE

PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

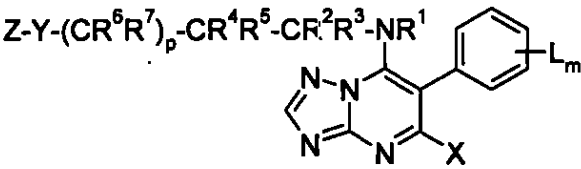
SOLICITUD DE:		
1	☒ Patente de Invención. ☐ Capítulo I.	☐ Patente de Modelo de Utilidad. ☒ Capítulo II.
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: BASF AKTIENGESellschaft, sociedad constituida y existente bajo las leyes de la República Federal de Alemania. Dirección: 67056 Ludwigshafen, República Federal de Alemania. Domicilio: 67056 Ludwigshafen, República Federal de Alemania	IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@camyp.com. Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número <u>438.019</u> T.P <u>31.929</u>
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Carsten BLETNER Unit. A 4/F, No. 23 Repulse Bay Road Hong Kong, China 2. Jordi TORMO I BLASCO Carl-Benz-Str. 10-3 69514 Laudendbach, República Federal de Alemania. 3. Bernd MÜLLER Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, República Federal de Alemania 4. Markus GEWEHR Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, República Federal de Alemania 5. Wassilios GRAMMENOS Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, República Federal de Alemania 6. Thomas GROTE Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, República Federal de Alemania 7. Udo HÜNGER Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz, 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. Jochen DIETZ Spelzenstr. 2ª. 68167 Mannheim República Federal de Alemania 13. John-Bryan SPEAKMAN In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, República Federal de Alemania. 14. Thorsten JABS, Richard-Wagner-str. 52 g, 67454 HaBloch, 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

2

	8. Joachim RHEINHEIMER Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen, República Federal de Alemania 9. Peter SCHÄFER Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, República Federal de Alemania	17. Maria SCHERER Hermann-Jürgens-Strasse.30, 76829 Landau República Federal de Alemania 18. Reinhard STIERL Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, República Federal de Alemania	
5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2005/009456</u> Fecha: <u>Septiembre 02 de 2005</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2006/027170 A1</u> Fecha: <u>Marzo 16 de 2006</u>		
6	Título (54) <u>6-FENIL-7-AMINO-TRIAZOLOPIRIMIDINAS. PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE CONTIENEN LAS MISMAS.</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 487/04</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>DE</u>	(32) Fecha <u>Septiembre 08 de 2004</u>
			(31) Número de Solicitud <u>102004043836.6</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>07-24,402</u> Fecha: <u>Marzo 26 DE 2007</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 482.000.oo. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes, si fuere el caso. ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☒ Traducción de los anexos 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 Caract rística



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA : 
C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

MGT

Documentos anexos

1. ☒ Publicación Internacional WO 2006/027170 A1
Páginas en el idioma original 69
Páginas en español 92
Reivindicaciones: Número (s) 13
Figuras: Número (s)
2. ☒ **Forma PCT/ISA/210**. Informe de Búsqueda Internacional.
3. ☒ Extracto de publicación.

**SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República
Federal de Alemania

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-38, 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, transgír, 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

ppa. Welzel

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° 72-38, 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 Malungen 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 Beamter, oder Kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendeten, einer oder anderen, ordnungswiese werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Ausserdem, und unter dieselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwälte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unsere) industriellen Eigentum zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu dem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n), damit sie uns vor beliebigen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Marken-, Defensiv- und Servicezeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen- und Zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Names und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertraglizenz; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmassnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit 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.

Unterzeichnete am 17 März 1989

in D-6700 Ludwigshafen

PAULO MENDEZ BARAJAS

NOTARIO

Unterschrift

ppa. Richters



U.R.Nr. 1407/89

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
Notarassessor
als amtlich bestellter Vertreter
des Notars Dr. Georg Ad. Kohler

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

Thomas W a l t e r

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-



Präsident des Landgerichts

(Franz Serfas)



Kostenvermerk: Gebühr 20,-- DM

LUZ ARMADA DE REPUBLICA
AUTONOMA E...
Cedula No. 566 M...
1002021



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) representan-
te(s) legal(es) en este país.

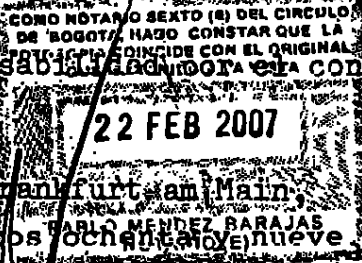
El Cónsul General no asume responsabilidad por el con-
tenido del documento.

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

Frankfurt a. M. 06 APR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por Ptas. 600 de Ley E. S. N. N.



No - 0077



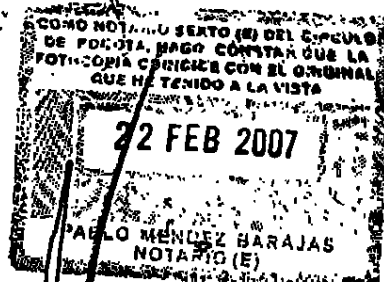
Marta N. de Stand
Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

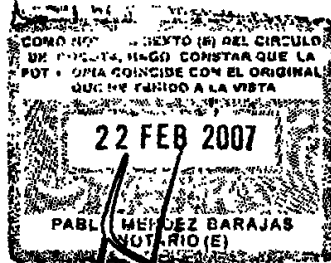
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 12 ABR 1989 No. 85061
MASE CONCTER
C. el Sr. Cartra Nino
cuyo firma aparece al pie del presente
documento, desempeñaba en esa fecha
las funciones de:

22 FEB 2007
PABLO ENRIQUE BARAJAS
STAFF (E)
MICHAEL E. MASCOSO ACUÑA
Jefe de Oficina, Generales

Die konsularische Legalisierung ist notwendig.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según los artículos 35 del C. de P. C. y 480 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social, que quien confiere el poder es su representante y puede otorgar poder, seguidamente autenticar la firma de éste.





LEA LAS INSTRUCCIONES
DEBIDO A QUE TODOS LOS

ESTE FOLIO, LARGO,
CON ALGUN VALOR

LA CERO (0)

881051599854

B C C 15
SUTURAL CORPORATIVA

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

1 Administración de impuestos de:		Código	2 Teléfono
BOGOTÁ		0.3	2120100
3 Documento de identificación (marque X) C.C. 6 T.I. ☐ NIT. ☒ No. 860041367 D.V. ☒		4 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 80 caracteres). CAVELIER ABOGADOS	
5 Documento de identificación (marque X) C.C. 4 T.I. ☒ NIT. ☐ No. 19' 301.629 D.V. ☐		6 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (máximo 80 caracteres). FORERO ROCHA JAIME	
7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4) Cra. 4a. No. 72-35		Municipio BOGOTÁ	Departamento CUNDINAMARCA
8 Número documento 1			
9 Relación oficial, Razón Social de documentos, folio número, fecha, valor y naturaleza de la transacción TITULO TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989 PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER COLO 0361-52-218-8			

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

Responsable del pago	
Nombre	
C.C. No.	19301629

PAGO EN BANCOS	VALORES	IMPORTE DEL IMPUESTO/PAGAR	VP	750
			VS	
			IM	
			TP	

DEM-31-V-08

CONTRIBUYENTE

1-037
750.00
22 FEB 2007
COMO NOTARIO SE TO (E) DEL CIRCULO
DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
PABLO MENDEZ BARAJAS
NOTARIO (E)

MM 1630/08

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:)

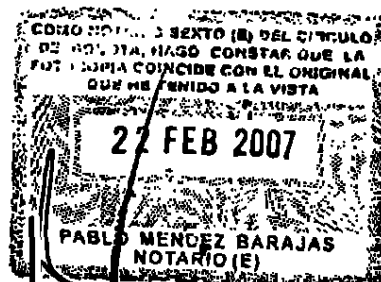
Protocolo notarial No. 1407/89

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.

1



LUZ ARRIAGA DE HERBES
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Estación No. 599 Minutaria

10

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

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr. Siegfried Kohler

Fdo.: firma ilegible

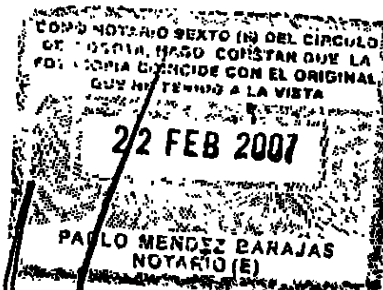
Notario de Ludwigshafen

Th. Walter

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

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

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



El Presidente del Tribunal Regional

Fdo.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

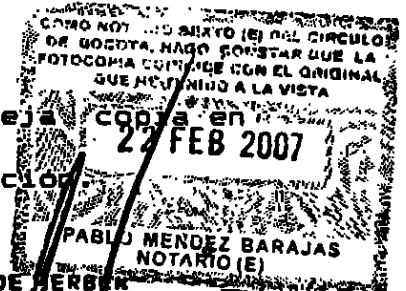
El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20,-- DM

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

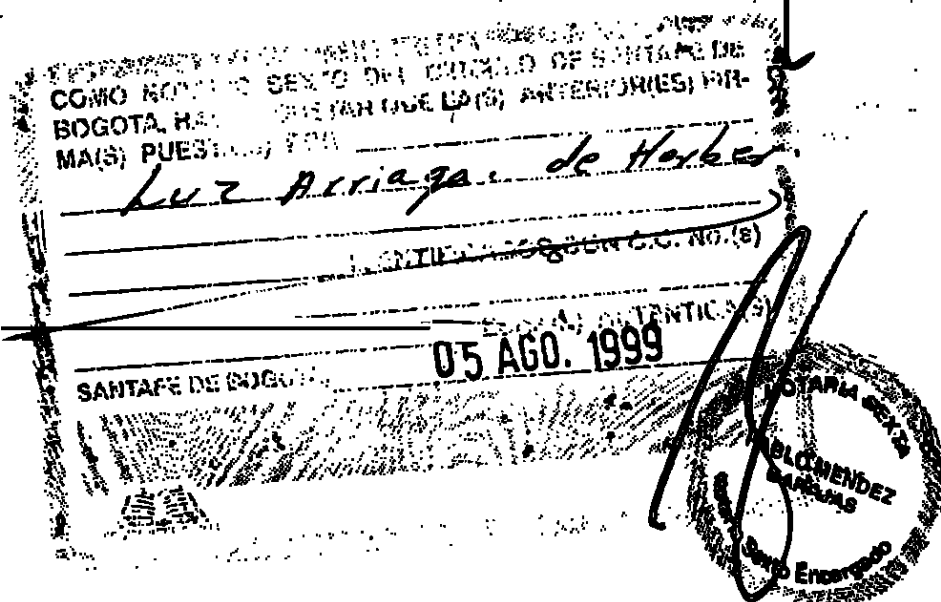
Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

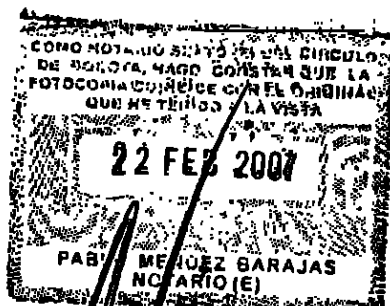
ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja
los archivos de estas oficinas para su confrontación
Bogotá, 26 de abril de 1989



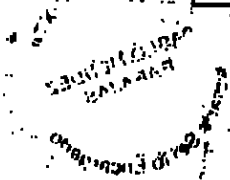
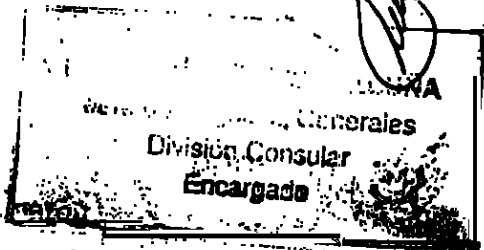
LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Registación No. 599 Minjusticia





MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 28 ABR. 1985 No. 89043
HACE CONSTAR
Que el señor LUZ DE HEREDIA
cuya firma aparece al pie del presunto
documento, desempeña en esa fecha
las funciones allí indicadas.



12

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLES: CAVELEYES

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

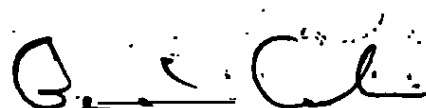
Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

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

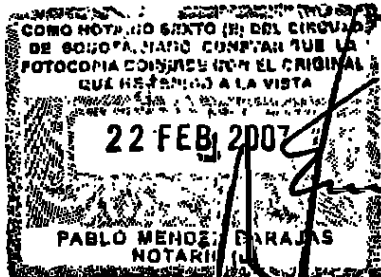
Señor Jefe,

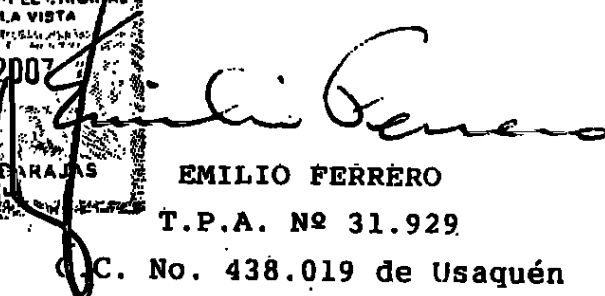

GERMAN CAVELIER.

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. mporecio, el Doctor SMI/10 EXASIA

quien exhibió la cédula de ciudadanía número 428.97
expedida en VIAQUER y la tarjeta profesional
número 21.924 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: B.D. MUJINAS (Asistente)
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

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

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá-C. mporecio, el Doctor SMI/10 EXASIA

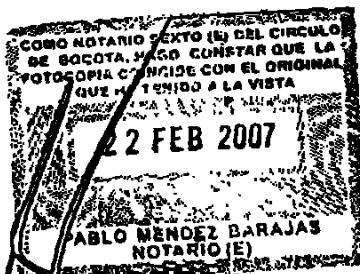
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 2072224
expedida en 27 y la tarjeta profesional
número 832 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



586

13

Colombia

0000055874

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

CESION

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

domiciliado(s) en

ASSIGNMENT

I (we), the undersigned

Carsten Blettner
Unit A, 4/F, No. 23 Repulse Bay Road, Hong Kong
China
Citizen of Germany

Jordi Tormo i Blasco
Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach
Germany
Citizen of Spain

Bernd Müller
Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany

Markus Gewehr
Goethestr. 21, 56288 Kastellaun
Germany
Citizen of Germany

Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece

Thomas Grote
Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim
Germany
Citizen of Germany

Udo Hüniger
Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz
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

14

Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

Jochen Dietz
Spelzenstr. 2a, 68167 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

John-Bryan Speakman
In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim
Germany
Citizen of United Kingdom

Thorsten Jabs
Richard-Wagner-Str.52g, 67454 Haßloch
Germany
Citizen of Germany

Siegfried Strathmann
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof
Germany
Citizen of Germany

Ulrich Schöfl
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Germany
Citizen of Germany

Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau
Germany
Citizen of Germany

Reinhard Stierl
Jahnstr.8, 67251 Freinsheim
Germany
Citizen of Germany

domiciliado(s) en

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

6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes for their preparation
and their use for controlling harmful fungi, and also compositions
comprising them

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

BASF Aktiengesellschaft

constituida y existente de conformidad con las leyes de

Alemania

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

6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes for their preparation
and their use for controlling harmful fungi, and also compositions
comprising them

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

domiciliada en

67056 Ludwigshafen, Alemania

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

pdcoass.rdf

15

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

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

Dado y firmado hoy

Given and signed this

22 Sep. 2005

Firma

Signature



Frank Schieweck In proxy for Carsten Blettner



Jordi Tormo i Blasco



Bernd Müller



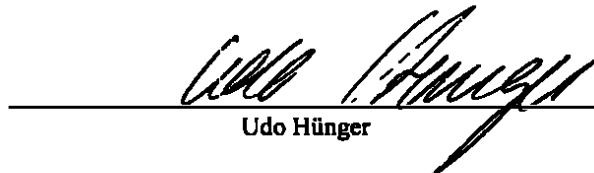
Markus Gewehr



Wassilios Grammenos



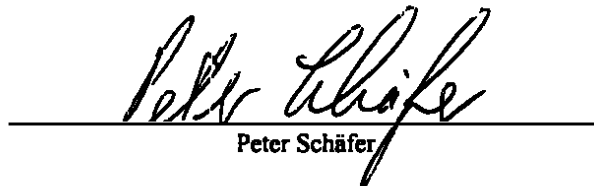
Thomas Groß



Udo Hüniger



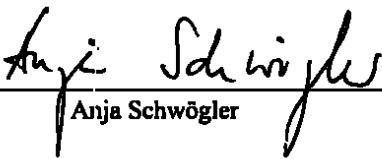
Joachim Rheinheimer



Peter Schäfer



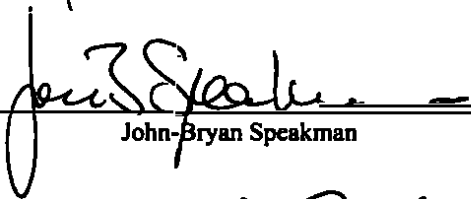
Frank Schieweck



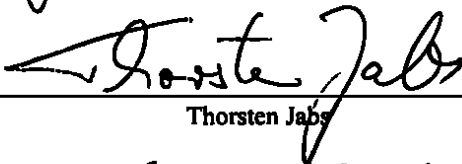
Anja Schwögl



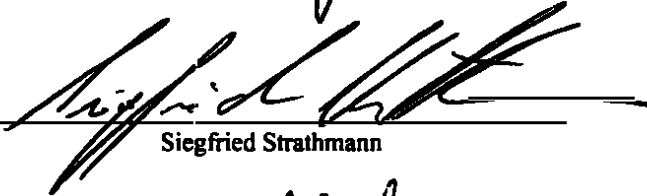
Jochen Dietz



John-Bryan Speakman



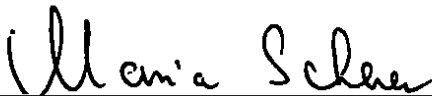
Thorsten Jabs



Siegfried Strathmann



Ulrich Schöfl



Maria Scherer



Reinhard Stierl

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

U.R.Nr. 2546/2005

I, Alfred Kluge, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

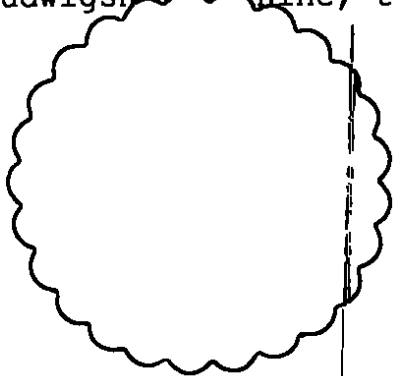
1. Mr. Frank **Schieweck**, residing at Lindenweg 4,
67258 Heßheim, Germany, personally known to me,

Mr. Schieweck is acting
i) on his own behalf,
ii) in proxy for
Mr. Carsten **Blettner**, residing at Unit A, 4/F,
No. 23 Repulse Bay Road, Hong Kong China,
Citizen of Germany,
the proxy is attached hereto,
2. Mr. Jordi **Tormo i Blasco**, residing at Carl-
Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach, Germany,
personally known to me,
3. Mr. Bernd **Müller**, residing at Stockinger Str.7,
67227 Frankenthal, Germany, personally known to
me,
4. Mr. Markus **Gewehr**, residing at Goethestr. 21,
56288 Kastellaun, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-
Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Germany,
personally known to me,
6. Mr. Thomas **Grote**, residing at Im Höhnhausen
18, 67157 Wachenheim, Germany, personally known to
me,
7. Mr. Udo **Hüniger**, residing at Kurt-Schumacher-
Str. 43, 55124 Mainz, 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,

- A
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. Jochen **Dietz**, residing at Spelzenstraße
2 a, 68167 Mannheim, Germany, personally known to
me,
 13. Mr. John-Bryan **Speakman**, residing at In den
Hahndornen 7, 67273 Bobenheim, Germany,
personally known to me,
 14. Mr. Thorsten **Jabs**, residing at Richard-Wagner-
Str. 52 g, 67454 Haßloch, 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. Mrs. Maria **Scherer**, residing at Hermann-
Jürgens-Str. 30, 76829 Landau, Germany,
personally known to me,
 18. Mr. Reinhard **Stierl**, residing at Jahnstr. 8,
67251 Freinsheim, Germany, personally known to
me,

are true and valid.

Ludwigshafen am Rhine, this 22nd day of September, 2005



Wert 5.112,92 €

notary public

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

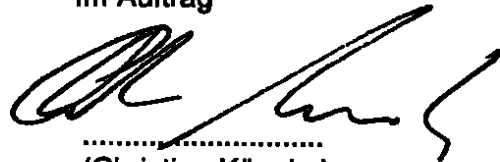
1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
K l u g e
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Alfred Kluge
in Ludwigshafen am Rhein

Bestätigt

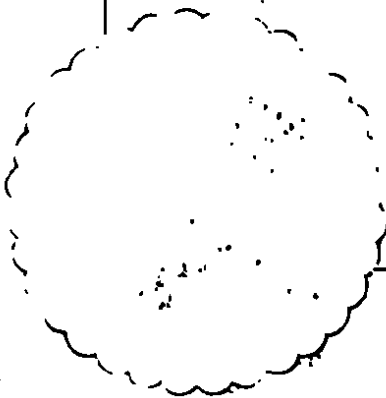
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 12. Oktober 2005
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1158-1161/05

9. Siegel/Stempel:

10. Unterschrift
Im Auftrag



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



Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €

21

certified copy

To all to whom these presents shall come:

I, **Lester G. Huang** *Notary Public*, duly authorised and sworn, residing and practising in the Hong Kong Special Administrative Region of the People's Republic of China

Do Hereby Certify that on this day and date before me personally came and appeared Dr. Carsten Georg BLETTNER (Holder of Hong Kong Identity Card No.R355850(8)) (in the document annexed to this certificate known as Dr. Carsten Blettner), who in my presence and in the presence of Dr. jur. Harald Feltkamp (Holder of Hong Kong Identity Card No.P925673(7)), both being present at the same time, did sign his name on the said document annexed, and the said Dr. Harald FELTKAMP did also attest such signature of Dr. Carsten Georg BLETTNER by signing his name on the said document annexed, and I certify that the signature of Dr. Carsten Georg BLETTNER subscribed on the document annexed is of the own, true and proper handwriting of the said Dr. Carsten Georg BLETTNER.

In Testimony whereof, I have hereunto subscribed my name and affixed my seal of office, this 12th day of August in the Year Two Thousand and Five


Lester G. Huang

Notary Public,
1225, Prince's Building, Central, Hong Kong SAR

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: Hong Kong, China

This public document

2. has been signed by Lester Garson Huang

3. acting in the capacity of Notary Public

4. bears the seal/stamp of Lester Garson Huang

Certified

5. at High Court 6. the 16 AUG 2005

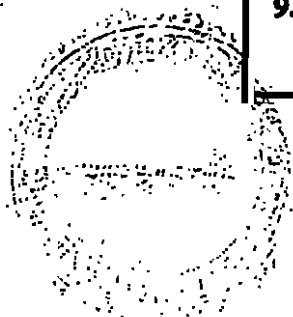
7. by Lung Kim Wan
Deputy Registrar, High Court

8. No 7190/2005

9. Seal/stamp

10. Signature:

Lung Kim Wan



22

PROXY

I, Dr. Carsten Blettner, living Unit A, 4/F, No.23 Repulse Bay Road, Hong Kong, former employee of BASF Aktiengesellschaft, D-67056 Germany and now employee of BASF East Asia, Regional Headquarters Ltd, 44th Floor, Jardine House, No.1 Connaught Place, Central Hong Kong, hereby authorize

Dr. Frank Schieweck

having its business address at BASF Aktiengesellschaft, D-67056 Ludwigshafen, Germany,

to act for me and to sign in my name and on my behalf any and all assignments or power of attorneys for patents and patent applications in which I am involved as inventor or co-inventor for all corresponding countries.

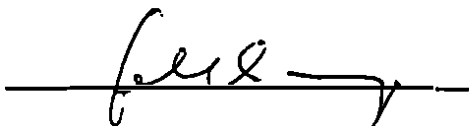
This Proxy shall be valid until December 31, 2006.

Hong Kong, 12th August 2005



Dr. Carsten Blettner

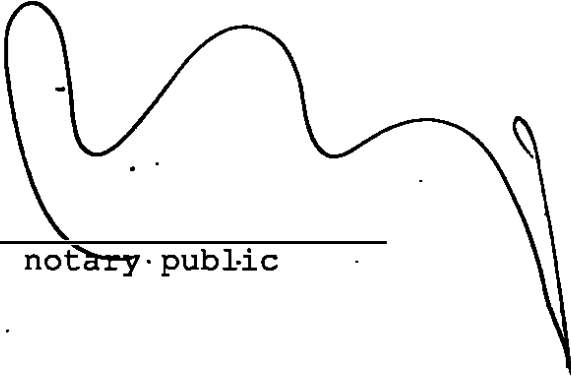
I, Dr. jur. Harald Feltkamp, Director Legal and Tax of BASF East Asia Regional Headquarters Ltd., herewith confirm to have witnessed the signature of Dr. Carsten Blettner.



I hereby certify the copy reproduced above to be
a true and correct copy of the original record.

Ludwigshafen/Rhine, this 22nd day of September, 2005





notary public

23

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
K l u g e
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Alfred Kluge
in Ludwigshafen am Rhein

Bestätigt

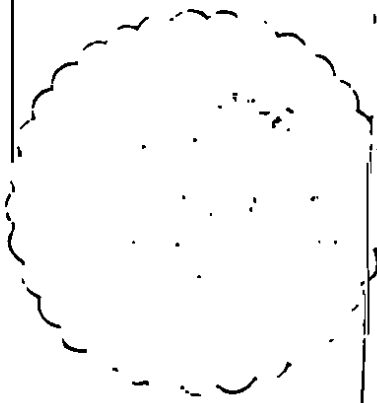
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 12. Oktober 2005
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1162/05

9. Siegel/Stempel:

10. Unterschrift
Im Auftrag



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



Kostenvermerk:
Gebühr 13,-- €

COLD00361 841 1593

TRADUCCION OFICIAL No. 11833

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

0000055874

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
Unit A, 4/F, No. 23 Repulse Bay Road, Hong Kong
China
Ciudadano de Alemania

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

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

Markus Gewehr
Goethestr. 21. 56288 Kastellaun
Alemania
Ciudadano de Alemania

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

Thomas Grote
Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

Udo Hüniger
Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz
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

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL


Resolución No.599 Minjusticia

Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

Anja Schwögl
Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

Jochen Dietz
Spelzenstr. 2a, 68167 Mannheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

John-Bryan Speakman
In den Hahndornen 7, 67273 Bobenheim
Alemania
Ciudadano del Reino Unido

Thorsten Jabs
Richard-Wagner-Str. 52g, 67454 Haßloch
Alemania
Ciudadano de Alemania

Siegfried Strathmann
Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof
Alemania
Ciudadano de Alemania

Ulrich Schöfl
Erlenstr. 8, 68782 Brühl
Alemania
Ciudadano de Alemania

Maria Scherer
Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Landau
Alemania
Ciudadana de Alemania

Reinhard Stierl
Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim
Alemania
Ciudadano de Alemania

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

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

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No. 5-9 Minjusticia

26

correspondiente en la República de Colombia. Hay dieciocho firmas ilegibles de los mencionados señores.- Dado y firmado el 22 de septiembre de 2005 en Ludwigshafen, Alemania.-

Sigue certificación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Alfred Kluge, el 22 de septiembre de 2005 bajo el protocolo notarial Urk.R. No. 2546 / 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 Kluge
- 3. Actuando en calidad de notario público
- 4. Lleva el sello oficial del notario Alfred Kluge,
notario de Ludwigshafen am Rhein

OS: H A PS 973 1095
34024 04
04.09.2005 10:33

Certificado

- 5. en Frankenthal (Pfalz)
- 6. el 12 de octubre de 2005
- 7. por el Presidente del Tribunal Regional
- 8. bajo el No. 91 Eb – 1158-1161/05
- 9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma
Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

200909
20.09.2009 11:11

Costas:
Derechos 12,00 €

Siguen documentos en idioma inglés y certificación notrial en inglés de la autenticidad de las copias de dichos documentos por el notario de Ludwigshafen/ Rhein, Alfred Kluge, el 22 de septiembre de 2005.-

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

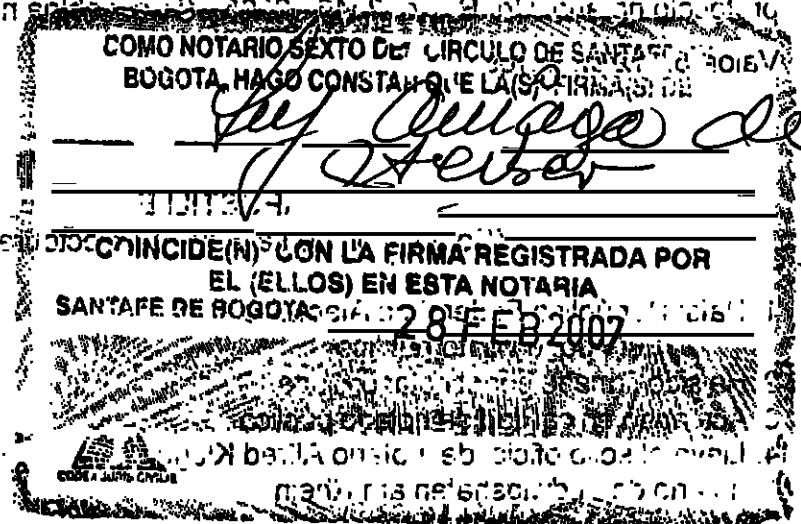
El presente documento es una copia de la original que se encuentra en el archivo de la Notaría Sexta de Bogotá, D.C., y no tiene validez legal. Fecha y hora de expedición: 28 de febrero de 2007.

El presente documento es una copia de la original que se encuentra en el archivo de la Notaría Sexta de Bogotá, D.C., y no tiene validez legal. Fecha y hora de expedición: 28 de febrero de 2007.

NO ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

2007 FEB 28 A 11:20

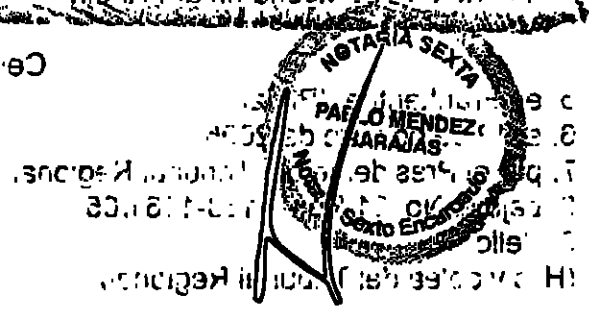
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.



MINISTERIO DE
RELACIONES
EXTERIORES

828905
Cuya firma aparece en el
documento en su
LAS FUNCIONES INDICADAS

Delante de mí
Notario
Pública
Firma
Notario



27

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 Kluge
 3. Actuando en calidad de notario público
 4. Lleva el sello oficial del notario Alfred Kluge,
notario de Ludwigshafen am Rhein
- Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 12 de octubre de 2005
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91-Eb - 1.162/05
9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma
Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

Costas:
Derechos 13,00 €

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

Bogotá, 23 de febrero de 2007.
C. 3450

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No.590 Mijusticia

MINISTERIO DE
RELACIONES
EXTERIORES

NO ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

828904
Luz Amaga
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

2007 FEB 28 A 11:20
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

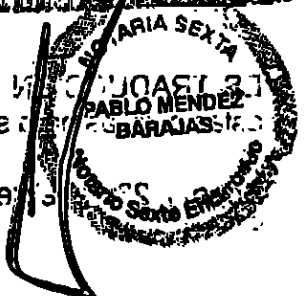
COPIA DE LA FIRMA DEL NOTARIO
FOTOCOPIA

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

28 FEB 2007

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

[Firma]



TRADUCCIÓN OFICIAL 052/2007 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

Carsten Blettner

Unit A, 4/F, No. Repulse Bay Road, Hong Kong, China, ciudadano de Alemania;

Jordi Tormo i Blasco

Carl-Benz-Str. 10-3, 69514, Laudenbach, Alemania, ciudadano de España;

Bernd Müller

Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal, Alemania, ciudadano de Alemania;

Markus Gewehr

Goethestr. 21, 56288 Kastellaun, Alemania, Ciudadano de Alemania;

Wassilios Grammenos

Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano griego;

Thomas Grote

Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim, Alemania, ciudadano alemán

Udo Hüniger

Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz, Alemania, ciudadano alemán

Joachim Rheinheimer

Merziger Str. 24 67063 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano alemán;

Peter Schäfer

Römerstr. 1, 67308 Ottersheim, Alemania, ciudadano alemán;

Frank Schieweck

Lindenweg 4, 67258 Hessheim, Alemania, ciudadano alemán

Anja Schwögler

29

Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165, Mannheim, Alemania, ciudadano alemán;

Jochen Dietz

Spelzenstr. 2ª, 68167 Mannheim, Alemania, ciudadano alemán;

John-Bryan Speakman

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

Thorsten Jabs

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

Siegfried Strathmann

Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof, Alemania ciudadano alemán;

Ulrich Schöfl

Erlenstr. 8, 68782 Brühl, Alemania, ciudadano alemán;

.María Scherer

Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Landau, Alemania, ciudadano alemán;

Reinhard Stierl

Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim, Alemania, ciudadano alemán

DECLARAN BAJO JURAMENTO SER LOS INVENTORES ÚNICOS Y VERDADEROS DE LA INVENCION **6-fenil-7-amino-triazdopirimidinas, procedimientos para su preparación y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como composiciones que contienen las mismas** ADEMÁS QUE CEDEN SIN RESERVAS NI LIMITACIONES EN FAVOR DE **BASF AKTIENGESSELLSCHAFT**, UNA SOCIEDAD CONSTITUIDA Y EXISTENTE DE CONFORMIDAD CON LAS LEYES DE ALEMANIA, DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, TODOS LOS DERECHOS INHERENTES A DICHA INVENCION Y QUE LA CITADA COMPAÑIA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE EN LA REPUBLICA DE COLOMBIA. DADO Y FIRMADO POR TODOS LOS INVENTORES ARRIBA CITADOS.

PODER

Yo, Dr. Carsten Blettner, domiciliado en Unit A, 4/F, No. 23, Repulse Bay Road, Hong Kong, expleado de BASF AKTIENGESELLSCHAFT, D-67056, Alemania y actualmente empleado de BASF East Asia, Regional Headquarters Ltd, Piso 44, Jardine House, No. 1, Connaught Place, Central Hong Kong, por el presente autorizo al DR. FRANK SCHIEWECK, domiciliado en BASF Aktiengesellschaft, D-67056, Ludwigshafen, Alemania, para actuar a mi nombre y firmar también a mi nombre todas las cesiones o poderes para patentes y solicitudes de patente en que yo aparezco como inventor o co-inventor en todos los países correspondientes. Este poder será válido hasta el 31 de diciembre de 2006.

Hong Kong, 12 de agosto de 2005.

Firmado: Dr. Carsten Blettner

Yo, Doctor en derecho Harald Feltkamp, director jurídico y de impuestos de BASF East Asia Regional Headquarters Ltd, confirmo haber presenciado la firma del Dr. Carsten Blettner.

Firma ilegible.

Por la presente certifico que la copia arriba reproducida es una copia verídica y correcta del registro original.

Ludwigshafen/Rhine, 22 de septiembre de 2005.

Firmado: notario público

Copia certificada:

A quien corresponda:

Yo, Lester G Huang, notario público debidamente autorizado y juramentado, domiciliado y practicante en la región administrativa especial de Hong Kong de la República Popular China, por la presente certifico que hoy ante mí compareció personalmente el DR. CARSTEN GEORG BLETTNER (portador de la Tarjeta de Identidad No. R355850(8) (identificado en el documento adjunto como DR. CARSTEN BLETTNER) quien en mi presencia y en la presencia del Doctor en derecho HARALD FELTKAMP

(portador de la tarjeta de identidad No. P925673(7), ambos presentes simultáneamente, firmaron el dicho documento adjunto, y el Dr. Harald FELTKAMP también certificó la firma del Dr. Carsten Georg BLETTNER, firmando en el documento adjunto. Certifico que la firma del Dr. Carsten Georg BLETTNER que aparece en el documento adjunto es la firma propia y verídica y la caligrafía de dicho DR. Carsten Georg BLETTNER.

En testimonio de lo cual, he firmado y fijado mi sello official, hoy 12 de agosto de 2005.

Firmado: LESTER G. HUANG, notario público
1225, Prince's Building, Central Hong Kong SAR.

APOSTILLE

(CONVENCIÓN DE LA HAYA DEL 5 DE OCTUBRE DE 1961)

1. País: HONG KONG, CHINA

Este documento público

2. ha sido firmado por LESTER GARSON HUANG

3. quien actúa en su calidad de NOTARIO PÚBLICO

4. lleva el sello/estampilla de LESTER GARSON HUANG

CERTIFICADO

5. en la ALTA CORTE 6. el 16 de agosto de 2005

7. por LUNA KIM WAN, ALTA CORTE, REGISTRADOR SUPLENTE

8. 7190/2005

9. Sello/estampilla: SELLO DE LA ALTA CORTE HONG KONG

10. Firma: (ILEGIBLE)

APOSTILLA # 91 Eb-1158-1161/05

APOSTILLA #91 Eb-1162/05

COLO-00361-841-159-3

WPCL002G ID.8596

Bogotá, 28 de febrero de 2007.

Edmundo Calado N.
Edmundo Calado Noguera
"TRADUCTOR OFICIAL"
INGLÉS - ESPAÑOL
Des. 31 de febrero de 1970

MINISTERIO DE
RELACIONES
EXTERIORES

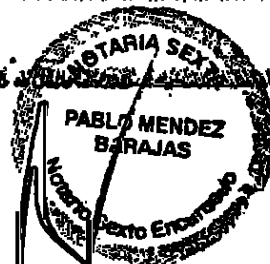
NO ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

8288006
Edwards Calado
COPIA FIRMADA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

2007 FEB 28 A 11:21

Edwards Calado
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE
Pablo Menendez Barajas
COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
SANTAFE DE BOGOTA, 28 FEB 2007



(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
16. März 2006 (16.03.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/027170 A1

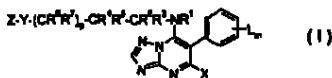
(51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 487/04 (2006.01) C07D 249/00 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01) C07D 239/00 (2006.01)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/009456
(22) Internationales Anmeldedatum:
2. September 2005 (02.09.2005)
(25) Einreichungssprache: Deutsch
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 043 836.6
8. September 2004 (08.09.2004) 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/CN]; Unit A, 4/F, No. 23 Repulse Bay Road, Hong Kong (CN). TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudendbach (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wasillios [GR/DE]; Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhenhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). HÜNGER, Udo [DE/DE]; Kurt-Schumacher-Str. 43, 55124 Mainz (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

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 6-PHENYL-7-AMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF, THE USE THEREOF FOR CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI, AND AGENTS CONTAINING THE SAME

(54) Bezeichnung: 6-PHENYL-7-AMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) Abstract: The invention relates to 6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidines of formula (I), wherein the substituents have the following designations: R¹ represents hydrogen, alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, halogenocycloalkyl, alkenyl, halogenalkenyl, cycloalkenyl, halogenocycloalkenyl, alkynyl, halogenalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five-membered or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing between one and four heteroatoms from the group containing O, N or S; R² represents alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, halogenocycloalkyl, alkenyl, halogenalkenyl, cycloalkenyl, halogenocycloalkenyl, alkynyl, halogenalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five-membered or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing between one and four heteroatoms from the group containing O, N or S; R³, R⁴, R⁵, R⁶ represent hydrogen or one of the groups cited for R¹, R⁷ also being able to form a five-membered or six-membered saturated or unsaturated ring with R³ or R⁶, that can contain, in addition to carbon atoms and as a ring member, between one and three other heteroatoms from the group containing O, N and S; R³ and R⁴, R⁵ and R⁶, and R⁵ and R⁷ can respectively form, in order to form spiro groups, a C₂-C₅ alkylene, alkenylene, or alkynylene chain, which can be broken by between one and three heteroatoms from the group containing O, N and S; p represents 0 or 1; L represents halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, cyano, nitro, amino, alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonylamino, C(O)-R, S(O)_n-R; where n represents 0, 1 or 2; R represents hydrogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, amino, alkylamino, dialkylamino; m represents 1, 2, 3, 4 or 5; X represents halogen, cyano, alkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy or halogenalkoxy, Y represents oxygen or sulphur; Z represents hydrogen, alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, alkylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl, alkenyl, halogenalkenyl, cycloalkenyl, alkynyl, halogenalkynyl, phenyl, naphthyl, a five-membered to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing between one and four heteroatoms from the group containing O, N and S; or Z can also form, with R³ or R⁶, a five-membered or six-membered ring that can contain, in addition to carbon atoms and Y, one or two other heteroatoms from the group containing O, N and S, as a ring member; the groups R¹ to R⁷, Z and R being able to be substituted according to the description. The invention also relates to methods for producing said compounds, to agents containing the same, and to the use thereof for controlling plant pathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: 6-Phenyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R¹ Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenocycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogenocycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, R²

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

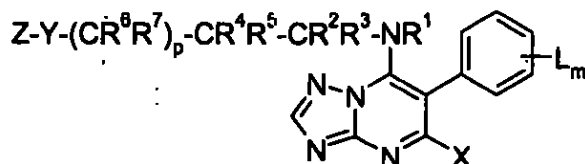
WO 2006/027170 A1

6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes for their preparation and their use for controlling harmful fungi, and also compositions comprising them

Description

5

The present invention relates to 6-phenyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are as defined below:

10 R^1 is hydrogen, C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15

R^2 is C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

20

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 are hydrogen or one of the groups mentioned under R^2 ,

25

R^4 , together with R^3 or R^6 , may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^8 ;

30

R^2 with R^3 , R^4 with R^5 , R^6 with R^7 may in each case together, with formation of carbonyl groups, also be oxygen and, with formation of spiro groups, form a C_2 - C_5 -alkylene, or alkenylene or alkynylene chain which may be interrupted by one to three heteroatoms from the group consisting of O, N and S;

35

R^1 to R^7 may in each case carry one to four identical or different groups R^8 :

R^8 is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -haloalkoxy, C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_8 -alkylthio, C_1 - C_8 -alkylamino, di- C_1 - C_8 -alkyl-

5

amino, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-haloalkenyloxy, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-alkynyloxy, C₃-C₈-haloalkynyloxy, C₃-C₈-cycloalkoxy, C₃-C₈-cycloalkenyloxy, oxy-C₁-C₃-alkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a 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,

10

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

15

R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocabonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocabonyl, dialkylaminothiocabonyl, where the alkyl groups in these radicals comprise 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals comprise 2 to 8 carbon atoms;

20

and/or one to three of the following radicals:

25

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclioxy, 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 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

30

p is zero or 1;

35

L is halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, cyano, nitro, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino, C₁-C₄-alkylcarbonylamino, C(O)-R, S(O)_n-R;

R is hydrogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy, C₂-C₄-alkynyloxy, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino; where the groups R may be substituted by one to three groups R^b;

n is zero, 1 or 2;

m is 1, 2, 3, 4 or 5;

5 X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy, C₂-C₄-alkynyloxy or C₁-C₂-haloalkoxy,

Y is oxygen or sulfur;

10 Z is hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alkenyloxycarbonyl, C₃-C₈-alkynyloxycarbonyl, C₃-C₈-cycloalkylcarbonyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-cycloalkoxycarbonyl, C₃-C₈-cycloalkenyloxycarbonyl, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-alkylthio, C₁-C₈-alkylsulfonyl, phenyl, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially
15 unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S; or

20 Z together with R⁵ or R⁷ may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms and Y, may comprise one or two further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a;

the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b;

25 R^A, R^B are independently hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl or C₃-C₈-cycloalkenyl;

30 R^A and R^B may combine with the nitrogen atom to which they are attached to form a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic ring which, as well as carbon atoms, may comprise from one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as a ring member and/or may carry one or more substituents R^a.

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

40 6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines are known in a general manner from EP-A 71 792. 6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines having 7-amino substituents comprising

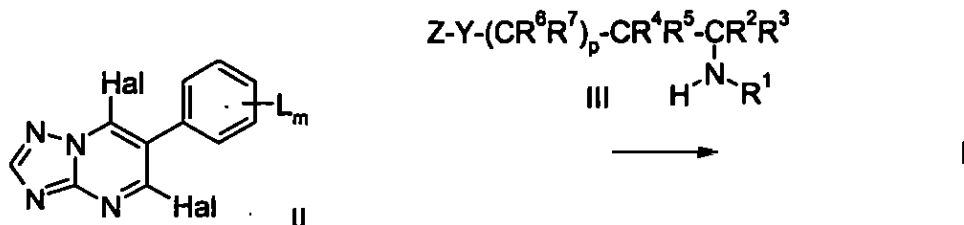
hydroxyl or ether groups are disclosed in EP-A 550 113, US 5 993 996, US 6 117 865, US 6 297 251 and WO 98/46607. These compounds are known to be suitable for controlling harmful fungi.

- 5 The compounds according to the invention differ from the compounds disclosed in the abovementioned applications by the specific embodiment of the 7-amino group, which is branched at the α -carbon atom.

10 In many cases, the activity of the known compounds is unsatisfactory. Based on this, 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 is achieved by the compounds defined at the outset. Furthermore, we have found processes and intermediates for their preparation, compositions comprising them and methods for controlling harmful fungi using the
15 compounds I.

The compounds according to the invention can be obtained by different routes. Advantageously, they are prepared by reacting 7-dihalotriazolopyrimidines of the
20 formula II with amines of the formula III in which the variables are as defined for formula I.



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,
25 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].

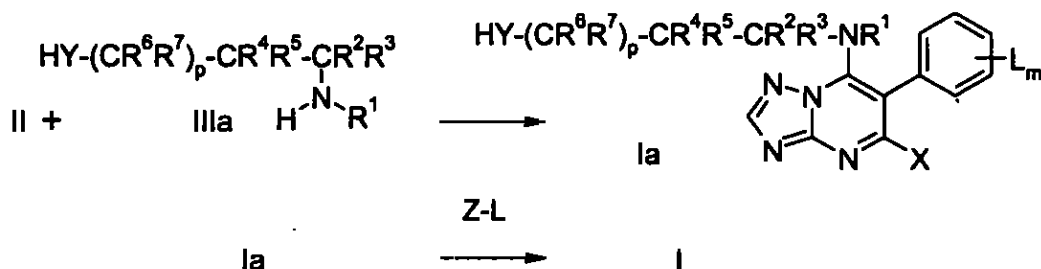
Preference is given to using a base, such as a tertiary amine, for example triethylamine
30 or an inorganic amine, such as potassium carbonate; it is also possible for excess amine of the formula III to serve as base.

By employing the 5,7-dihalotriazolopyrimidines known from EP-A 550 113 and EP-A 770 615, it is thus possible to access the 5-halotriazolopyrimidines of the formula I in
35 which X is halogen, preferably chlorine. They form a preferred subject matter of the invention. Other 5,7-dihalotriazolopyrimidines are accessible analogously to the

32

literature cited.

- Depending on the embodiment of the group Z in formula I, it may be advantageous to react II with an appropriate hydroxyl- or mercaptoamine (Z = hydrogen) of the formula
- 5 IIIa and to introduce the group Z at the stage of the 7-hydroxy or -mercaptoaminotriazolopyrimidine of the formula Ia formed, by etherification or esterification.



- To this end, the 7-hydroxy or -mercaptoaminotriazolopyrimidine of the formula Ia is reacted with an alkylating or acylating agent Z-L, where L is a nucleophilically replaceable group. The person skilled in the art is generally familiar with the reaction conditions suitable for the etherification or esterification [cf.: Organikum, VEB
- 10 Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin (1981)].

- 15 Amines of the formulae III and IIIa are known from the literature, can be prepared by known methods or are commercially available.

- Compounds of the formula I in which X is cyano, C₁-C₆-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy can be obtained in an advantageous manner by reacting compounds I, in which X is
- 20 halogen, preferably chlorine, with compounds M-X' (formula IV). Depending on the meaning of the group X' to be introduced, the compounds IV are inorganic cyanides, alkoxides or haloalkoxides. The reaction is advantageously carried out in the presence of an inert solvent. The cation M in formula IV is of little importance; for practical reasons, preference is usually given to ammonium, tetraalkylammonium or alkali metal
- 25 or alkaline earth metal salts.

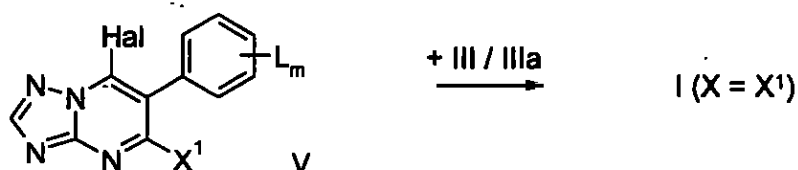


- The reaction temperature is usually from 0 to 120°C, preferably from 10 to 40°C [cf. J. Heterocycl. Chem., 12, (1975), 861-863].
- 30

- Suitable solvents including ethers, such as dioxane, diethyl ether and, preferably, tetrahydrofuran, halogenated hydrocarbons, such as dichloromethane and aromatic hydrocarbons, such as toluene.

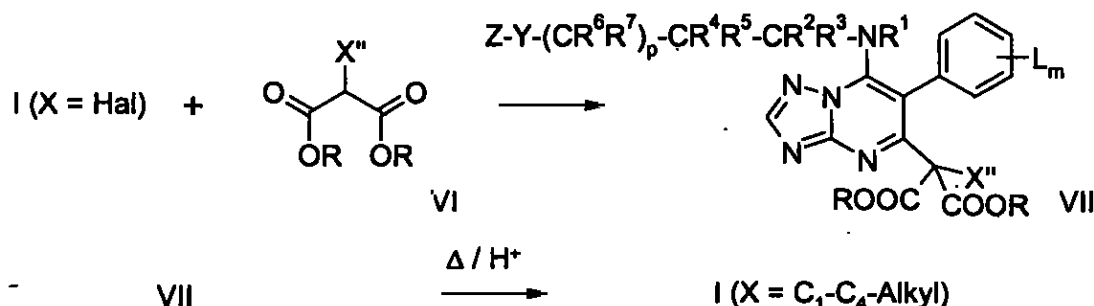
- 35 Compounds of the formula I in which X is C₁-C₄-alkyl can be obtained in an

advantageous manner via the following synthesis route:



The reaction of the 5-alkyl-7-halotriazolopyrimidines of the formula V in which X¹ is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl with amines III or IIIa is carried out under the conditions described further above. Compounds of the formula V are known from WO 03/093271 or can be prepared in accordance with the literature cited.

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



The malonates VI are known from the literature [J. Am. Chem. Soc., 64, (1942), 2714; J. Org. Chem., 39, (1974), 2172; Helv. Chim. Acta, 61, (1978), 1565], or they can be prepared in accordance with the literature cited.

The subsequent hydrolysis of the ester VII is carried out under generally customary conditions; depending on the various structural elements, alkali or acidic hydrolysis of the compounds VII may be advantageous. Under the conditions of ester hydrolysis, there may already be complete or partial decarboxylation to I.

The decarboxylation is usually carried out at temperatures of from 20°C to 180°C, preferably from 50°C to 120°C, in an inert solvent, if appropriate in the presence of an acid.

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

ether, tert-butyl methyl ether, dioxane, anisole and tetrahydrofuran, nitriles, such as acetonitrile and propionitrile, ketones, such as acetone, methyl ethyl ketone, diethyl ketone and tert-butyl methyl ketone, alcohols, such as methanol, ethanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol and tert-butanol, and also dimethyl sulfoxide, dimethyl-
 5 formamide and dimethylacetamide; with particular preference, the reaction is carried out in hydrochloric acid or acetic acid. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned.

Compounds of the formula I in which X is C₁-C₄-alkyl can also be obtained by coupling
 10 5-halotriazolopyrimidines of the formula I with organometallic reagents of the formula VIII. In one embodiment of this process, the reaction is carried out with transition metal catalysis, such as Ni- or Pd catalysis.



In formula VIII, M is a metal ion of valency Y, such as, for example, B, Zn or Sn, and X''
 15 is C₁-C₃-alkyl. This reaction can be carried out, for example, analogously to the following methods: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1994), 1187, *ibid.* 1 (1996), 2345; WO 99/41255; Aust. J. Chem., 43 (1990), 733; J. Org. Chem., 43 (1978), 358; J. Chem. Soc. Chem. Commun. (1979), 866; Tetrahedron Lett., 34 (1993), 8267; *ibid.* 33 (1992), 413.

20 The reaction mixtures are worked up in a customary manner, for example by mixing with water, separating the phases and, if appropriate, chromatographic purification of the crude products. Some of the intermediates and end products are obtained in the form of colorless or slightly brownish viscous oils which can be purified or freed from
 25 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.

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

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

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

20

halogen: fluorine, chlorine, bromine and iodine;

alkyl: saturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 1 to 4, 6 or 8
 5 carbon atoms, for example C_1 - C_8 -alkyl such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl,
 butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-
 methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl,
 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl,
 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-
 10 dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-
 trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl;

haloalkyl: straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 2, 4 or 6 carbon atoms
 (as mentioned above), where in these groups some or all of the hydrogen atoms may
 15 be replaced by halogen atoms as mentioned above; in particular, C_1 - C_2 -haloalkyl, such
 as chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl,
 difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl,
 chlorodifluoromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl,
 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl,
 20 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, pentafluoroethyl or 1,1,1-trifluoroprop-2-
 yl;

alkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 4, 6
 or 8 carbon atoms and one or two double bonds in any position, for example C_2 - C_8 -
 25 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-
 30 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-
 35 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-
 40 ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-

butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;

5 haloalkenyl: unsaturated straight-chain or branched hydrocarbon radicals having 2 to 8 carbon atoms and one or two double bonds in any position (as mentioned above), where in these groups some or all of the hydrogen atoms may be replaced by halogen atoms as mentioned above, in particular by fluorine, chlorine and bromine;

10 alkynyl: straight-chain or branched hydrocarbon groups having 2 to 4, 6 or 8 carbon atoms and one or two triple bonds in any position, for example C_2-C_8 -alkynyl, such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, 3-butylnyl, 1-methyl-2-propynyl, 1-pentylnyl, 2-pentylnyl, 3-pentylnyl, 4-pentylnyl, 1-methyl-2-butylnyl, 1-methyl-3-butylnyl, 2-methyl-3-butylnyl, 3-methyl-1-butylnyl, 1,1-dimethyl-2-propynyl, 1-ethyl-2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-methyl-2-pentylnyl, 15 1-methyl-3-pentylnyl, 1-methyl-4-pentylnyl, 2-methyl-3-pentylnyl, 2-methyl-4-pentylnyl, 3-methyl-1-pentylnyl, 3-methyl-4-pentylnyl, 4-methyl-1-pentylnyl, 4-methyl-2-pentylnyl, 1,1-dimethyl-2-butylnyl, 1,1-dimethyl-3-butylnyl, 1,2-dimethyl-3-butylnyl, 2,2-dimethyl-3-butylnyl, 3,3-dimethyl-1-butylnyl, 1-ethyl-2-butylnyl, 1-ethyl-3-butylnyl, 2-ethyl-3-butylnyl and 1-ethyl-1-methyl-2-propynyl;

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

25 five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S:

- 5- or 6-membered heterocyclyl which contains one to three nitrogen atoms and/or one oxygen or sulfur atom or one or two oxygen and/or sulfur atoms, for
30 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-
35 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 contain 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;

15 alkylene: divalent unbranched chains of 3 to 5 CH₂ groups, for example CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ and CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;

oxyalkylene: divalent unbranched chains of 2 to 4 CH₂ groups, where one valency is attached to the skeleton via an oxygen atom, for example OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ and OCH₂CH₂CH₂CH₂;

oxyalkyleneoxy: divalent unbranched chains of 1 to 3 CH₂ groups, where both valencies are attached to the skeleton via an oxygen atom, for example OCH₂O, OCH₂CH₂O and OCH₂CH₂CH₂O.

25

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

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

Preference is given to compounds I in which R¹ is hydrogen or C₁-C₄-alkyl, such as hydrogen or methyl or ethyl, in particular hydrogen.

35

In addition, preference is given to compounds I in which R² is C₁-C₈-alkyl or C₃-C₈-cycloalkyl, in particular C₁-C₆-alkyl or C₃-C₆-cycloalkyl, preferably methyl, ethyl, isopropyl, isobutyl, tert-Butyl, sec-pentyl, cyclopropyl or cyclopentyl, in particular tert-butyl.

Preference is likewise given to compounds I in which R^3 is hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl or C_3 - C_6 -cycloalkyl, in particular hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl or C_3 - C_6 -cycloalkyl, preferably hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl or isopropyl. If R^3 is an alkyl group, R^3 preferably has the same meaning as R^2 .

5

In a further embodiment of the compounds of the formula I, R^2 and R^3 together form a C_3 - C_6 -alkylene group, in particular a C_3 - C_4 -alkylene group.

10

In a further embodiment of the compounds of the formula I, R^4 , R^5 , R^6 and R^7 are each hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl, in particular hydrogen, methyl or ethyl, in particular hydrogen.

15

In a further embodiment of the compounds of the formula I, R^4 and R^5 and/or R^6 and R^7 , in each case together, form a C_3 - C_6 -alkylene, C_3 - C_6 -oxyalkylene or C_2 - C_5 -oxyalkyleneoxy group, in particular a C_3 - C_4 -alkylene group.

In a preferred embodiment of the compounds of the formula I, the index p has the value zero.

20

In a further preferred embodiment of the compounds of the formula I, Y is oxygen.

In a further embodiment of the compounds of the formula I, Z is a monovalent group.

25

In a preferred embodiment of the compounds of the formula I, Z is C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -alkylcarbonyl, in particular methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, acetyl, propan-1-one or butan-1-one.

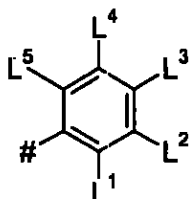
30

Preference is given to compounds I in which X is halogen, C_1 - C_4 -alkyl, cyano or C_1 - C_4 -alkoxy, such as chlorine, bromine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy, in particular chlorine.

35

In a preferred embodiment of the compounds I, at least one group L is located in the ortho-position to the point of attachment to the triazolopyrimidine skeleton, in particular chlorine, fluorine or methyl.

Moreover, particular preference is given to compounds I in which the phenyl group substituted by L_m is the group A



A

in which # is the point of attachment to the triazolopyrimidine skeleton and

L^1 is fluorine, chlorine, CH_3 or CF_3 ;

L^2, L^4 independently of one another are hydrogen or fluorine;

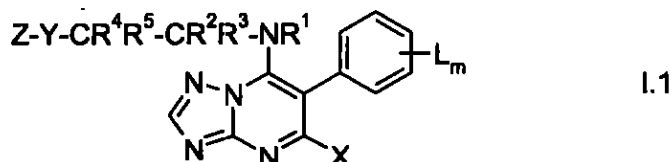
5 L^3 is hydrogen, fluorine, chlorine, CN, CH_3 , OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$, $N(CH_3)_2$, $C(O)NH_2$ or $C(O)CH_3$; and

L^5 is hydrogen, fluorine, chlorine or CH_3 .

Particular preference is given to compounds I in which L_m is one of the following

10 combinations of substituents: 2-fluoro-6-chloro, 2,6-difluoro, 2,6-dichloro, 2-fluoro-6-methyl, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-methoxy, 2-chloro-4-methoxy, pentafluoro, 2-methyl-4-fluoro, 2-trifluoromethyl, 2-methoxy-6-fluoro, 2-chloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-chloro, 2-chloro-4-fluoro, 2-chloro-5-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-methyl, 2,4-dimethyl, 2-methyl-4-chloro, 2-methyl-5-fluoro, 15 2-fluoro-4-methyl, 2,6-dimethyl, 2,4,6-trimethyl, 2,6-difluoro-4-methyl, 2-trifluoromethyl-4-fluoro, 2-trifluoromethyl-5-fluoro or 2-trifluoromethyl-5-chloro.

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



I.1

20

in which the variables are as defined above.

A further embodiment of the invention relates to compounds of the formula I.2,



I.2

25

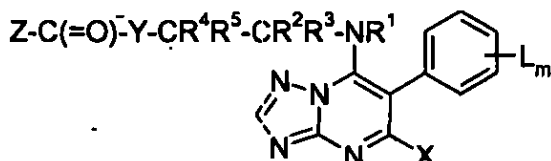
in which the variables are as defined above.

A further embodiment of the invention relates to compounds of the formula I and I.1 in which Z is a group attached via a carbonyl group.

30

These compounds conform in particular to the formula I.3:

45



I.3

in which the variables are as defined according to the formula I and Z is defined as follows:

- 5 hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-alkynyloxy, C₃-C₈-cycloalkoxy, C₃-C₈-cycloalkenyloxy, NR^AR^B, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N or S; the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b.
- 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.
- 15 In addition to the compounds mentioned in tables 1 to 64, the corresponding derivatives in which X is cyano, methyl or methoxy also form a preferred subject matter.

Table 1

- 20 Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-6-chloro and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 2

- 25 Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 3

- 30 Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-dichloro and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 4

- 35 Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-6-methyl and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

26

Table 5

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4,6-trifluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table A

Table 6

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro-4-methoxy and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for

10 each compound to one row of table A

Table 7

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is pentafluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table A

Table 8

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table A

Table 9

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

25 compound to one row of table A

Table 10

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methoxy-6-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

30 compound to one row of table A

Table 11

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound

35 to one row of table A

Table 12

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound

40 to one row of table A

Table 13

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table A

Table 14

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-4-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

10 compound to one row of table A

Table 15

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table A

Table 16

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,3-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table A

Table 17

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,5-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

25 compound to one row of table A

Table 18

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,3,4-trifluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

30 compound to one row of table A

Table 19

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound

35 to one row of table A

Table 20

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4-dimethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

40 compound to one row of table A

Table 21

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-4-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

5

Table 22

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-4-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

10

Table 23

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-dimethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

15

Table 24

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4,6-trimethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

20

Table 25

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro-4-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

25

Table 26

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

30

Table 27

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-5-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

35

Table 28

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-5-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

40

Table 29

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table A

Table 30

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-5-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

10 compound to one row of table A

Table 31

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-5-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table A

Table 32

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-methoxy and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table A

Table 33

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-6-chloro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

25 for each compound to one row of table A

Table 34

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

30 for each compound to one row of table A

Table 35

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-dichloro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

35 for each compound to one row of table A

Table 36

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-6-methyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

40 for each compound to one row of table A

Table 37

Compounds of the formula I.1, in which X is chlorine, L_m is 2,4,6-trifluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

5 for each compound to one row of table A

Table 38

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro-4-methoxy and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z

10 corresponds for each compound to one row of table A

Table 39

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is pentafluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table A

Table 40

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-4-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

20 for each compound to one row of table A

Table 41

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

25 for each compound to one row of table A

Table 42

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methoxy-6-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

30 for each compound to one row of table A

Table 43

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

35 compound to one row of table A

Table 44

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

40 compound to one row of table A

51

Table 45

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4-difluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 46

Compounds of the formula I.1, in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-4-chloro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 47

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 48

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,3-difluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 49

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,5-difluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 50

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,3,4-trifluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 51

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

Table 52

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4-dimethyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

52

Table 53

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-4-chloro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

5

Table 54

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-4-methyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

10

Table 55

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-dimethyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

15

Table 56

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,4,6-trimethyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

20

Table 57

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro-4-methyl and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

25

Table 58

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-4-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

30

Table 59

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-5-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

35

Table 60

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-5-chloro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound to one row of table A

40

Table 61

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

5 for each compound to one row of table A

Table 62

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-5-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

10 for each compound to one row of table A

Table 63

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-5-fluoro and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

15 for each compound to one row of table A

Table 64

Compounds of the formula I.1 in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-methoxy and R^1 is methyl, R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

20 for each compound to one row of table A

Table 65

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-6-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

25 compound to one row of table B

Table 66

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

30 compound to one row of table B

Table 67

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,6-dichloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

35 compound to one row of table B

Table 68

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-6-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

40 compound to one row of table B

Table 69

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,4,6-trifluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table B

Table 70

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro-4-methoxy and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for

10 each compound to one row of table B

Table 71

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is pentafluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table B

Table 72

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table B

Table 73

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

25 compound to one row of table B

Table 74

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-methoxy-6-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

30 compound to one row of table B

Table 75

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound

35 to one row of table B

Table 76

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound

40 to one row of table B

Table 77

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,4-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table B

Table 78

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-4-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

10 compound to one row of table B

Table 79

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table B

Table 80

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,3-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table B

Table 81

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,5-difluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

25 compound to one row of table B

Table 82

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,3,4-trifluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

30 compound to one row of table B

Table 83

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each compound

35 to one row of table B

Table 84

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,4-dimethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

40 compound to one row of table B

56

Table 85

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-4-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table B

Table 86

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-fluoro-4-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

10 compound to one row of table B

Table 87

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,6-dimethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table B

Table 88

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,4,6-trimethyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table B

Table 89

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2,6-difluoro-4-methyl and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds for

25 each compound to one row of table B

Table 90

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-4-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

30 for each compound to one row of table B

Table 91

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-5-fluoro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

35 for each compound to one row of table B

Table 92

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-trifluoromethyl-5-chloro and R^1 , R^4 and R^5 are hydrogen and the combination of R^2 , R^3 , Y and Z corresponds

40 for each compound to one row of table B

57

Table 93

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-fluoro and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each

5 compound to one row of table B

Table 94

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-5-fluoro and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each

10 compound to one row of table B

Table 95

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-methyl-5-fluoro and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each

15 compound to one row of table B

Table 96

Compounds of the formula I.3, in which X is chlorine, L_m is 2-chloro-4-methoxy and R¹, R⁴ and R⁵ are hydrogen and the combination of R², R³, Y and Z corresponds for each

20 compound to one row of table B

Table A

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-1	CH ₃	H	O	H
A-2	CH ₃	H	O	CH ₃
A-3	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-5	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-8	CH ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-9	CH ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-10	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-11	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-12	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-15	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-16	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-17	CH ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-18	CH ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-19	CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-20	CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-21	CH ₃	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-22	CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-23	CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-24	CH ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-25	CH ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-26	CH ₃	CH ₃	O	H
A-27	CH ₃	CH ₃	O	CH ₃
A-28	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-29	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-30	CH ₃	CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-31	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-32	CH ₃	CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-33	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-34	CH ₃	CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-35	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-36	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-37	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-38	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-39	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-40	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-41	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-42	CH ₃	CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-43	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-44	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-45	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-46	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-pyridyl)
A-47	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-48	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-49	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-50	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-51	CH ₂ CH ₃	H	O	H
A-52	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃
A-53	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-54	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-55	CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-56	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-57	CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-58	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-59	CH ₂ CH ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-60	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-61	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-62	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-64	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-65	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-66	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-67	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-68	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-69	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-70	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-71	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-72	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-73	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-74	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-75	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-76	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	H
A-77	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₃
A-78	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-80	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-81	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-82	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-83	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-84	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-85	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-86	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-87	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-88	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-89	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-90	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-91	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-92	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-93	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-94	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-95	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-96	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-pyridyl)
A-97	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-98	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-99	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-100	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-101	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	H
A-102	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃
A-103	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-104	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-105	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-106	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-107	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-108	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-109	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-110	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-111	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-112	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-113	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-114	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-115	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-116	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-118	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-119	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-120	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-121	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-122	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-123	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-124	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-125	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-126	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	H
A-127	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-128	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-129	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-130	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-131	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-132	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-133	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-134	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-135	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-136	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-137	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-138	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-139	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-140	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-141	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-142	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-143	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-144	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-145	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-146	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-pyridyl)
A-147	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-148	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-149	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-150	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-151	CH(CH ₃) ₂	H	O	H
A-152	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃
A-153	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₃
A-154	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-155	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-156	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-157	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-158	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-159	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(CH ₃) ₃
A-160	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₃
A-161	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-162	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-163	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-164	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-165	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-166	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-167	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-168	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-169	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-170	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-171	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-172	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-173	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-174	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-175	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-176	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	H
A-177	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₃
A-178	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₃
A-179	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-180	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH(CH ₃) ₂
A-181	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-182	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-183	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-184	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₃
A-185	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₃
A-186	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-187	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-188	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-189	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-190	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-191	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-192	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)C ₆ H ₅
A-193	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-194	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-195	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-196	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-pyridyl)
A-197	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-198	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-199	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-200	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-201	C(CH ₃) ₃	H	O	H

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-202	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₃
A-203	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-204	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-205	C(CH ₃) ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-206	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-207	C(CH ₃) ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-208	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-209	C(CH ₃) ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-210	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-211	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-212	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-213	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-214	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-215	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-216	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-217	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-218	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-219	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-220	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-221	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-222	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-223	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-224	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-225	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-226	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	H
A-227	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₃
A-228	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₃
A-229	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-230	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-231	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-232	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-233	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-234	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(CH ₃) ₃
A-235	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₃
A-236	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-237	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-238	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-239	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-240	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-241	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-242	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-243	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-244	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-245	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-246	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-247	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-248	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-249	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-250	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-251	c-C ₃ H ₅	H	O	H
A-252	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₃
A-253	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₃
A-254	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-255	c-C ₃ H ₅	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-256	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-257	c-C ₃ H ₅	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-258	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-259	c-C ₃ H ₅	H	O	C(CH ₃) ₃
A-260	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₃
A-261	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-262	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-263	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-264	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-265	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-266	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-267	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-268	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-269	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-270	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-271	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-272	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-273	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-274	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-275	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)

65

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-276	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	H
A-277	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₃
A-278	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-279	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-280	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-281	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-282	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-283	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-284	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-285	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-286	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-287	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-288	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-289	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-290	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-291	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-292	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-293	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-294	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-295	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-296	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-pyridyl)
A-297	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-298	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-299	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-300	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-301	c-C ₅ H ₉	H	O	H
A-302	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₃
A-303	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₃
A-304	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-305	c-C ₅ H ₉	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-306	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-307	c-C ₅ H ₉	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-308	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-309	c-C ₅ H ₉	H	O	C(CH ₃) ₃
A-310	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₃
A-311	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-312	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-313	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-314	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-315	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-316	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-317	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-318	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-319	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-320	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-321	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-pyridyl)
A-322	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-323	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-324	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-325	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-326	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	H
A-327	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₃
A-328	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-329	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-330	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-331	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-332	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-333	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-334	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-335	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-336	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-337	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-338	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-339	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-340	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-341	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-342	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-343	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-344	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-345	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-346	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-pyridyl)
A-347	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-348	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-349	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-350	<i>c</i> -C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-351	-CH ₂ CH ₂ -		O	H
A-352	CH ₂ CH ₂		O	CH ₃
A-353	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₃
A-354	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-355	CH ₂ CH ₂		O	CH(CH ₃) ₂
A-356	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-357	CH ₂ CH ₂		O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-358	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-359	CH ₂ CH ₂		O	C(CH ₃) ₃
A-360	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₃
A-361	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-362	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-363	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-364	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-365	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-366	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-367	CH ₂ CH ₂		O	C(O)C ₆ H ₅
A-368	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-369	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-370	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-371	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-pyridyl)
A-372	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-373	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-374	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-375	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-376	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	H
A-377	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₃
A-378	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₃
A-379	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-380	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH(CH ₃) ₂
A-381	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-382	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-383	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-384	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(CH ₃) ₃
A-385	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₃
A-386	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-387	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-388	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-389	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-390	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-391	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-392	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)C ₆ H ₅
A-393	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-394	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-395	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-396	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-pyridyl)
A-397	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-398	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-399	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-400	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-401	CH ₃	H	S	H
A-402	CH ₃	H	S	CH ₃
A-403	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-404	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-405	CH ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-406	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-407	CH ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-408	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-409	CH ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-410	CH ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-411	CH ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-412	CH ₃	CH ₃	S	H
A-413	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃
A-414	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-415	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-416	CH ₃	CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-417	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-418	CH ₃	CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-419	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-420	CH ₃	CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-421	CH ₃	CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-422	CH ₃	CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-423	CH ₂ CH ₃	H	S	H

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-424	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₃
A-425	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-426	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-427	CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-428	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-429	CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-430	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-431	CH ₂ CH ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-432	CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-433	CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-434	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	H
A-435	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₃
A-436	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-437	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-438	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-439	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-440	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-441	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-442	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-443	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-444	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-445	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	H
A-446	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₃
A-447	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-448	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-449	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-450	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-451	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-452	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-453	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-454	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-455	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-456	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	H
A-457	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₃
A-458	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-459	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-460	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂

FO

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-461	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-462	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-463	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-464	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-465	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-466	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-467	CH(CH ₃) ₂	H	S	H
A-468	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₃
A-469	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₃
A-470	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-471	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-472	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-473	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-474	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-475	CH(CH ₃) ₂	H	S	C(CH ₃) ₃
A-476	CH(CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₃
A-477	CH(CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-478	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	H
A-479	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₃
A-480	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₃
A-481	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-482	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH(CH ₃) ₂
A-483	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-484	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-485	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-486	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₃
A-487	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	C(S)CH ₃
A-488	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-489	C(CH ₃) ₃	H	S	H
A-490	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₃
A-491	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-492	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-493	C(CH ₃) ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-494	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-495	C(CH ₃) ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-496	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-497	C(CH ₃) ₃	H	S	C(CH ₃) ₃

71

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-498	C(CH ₃) ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-499	C(CH ₃) ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-500	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	H
A-501	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₃
A-502	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₃
A-503	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-504	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-505	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-506	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-507	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-508	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	C(CH ₃) ₃
A-509	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₃
A-510	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-511	c-C ₃ H ₅	H	S	H
A-512	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₃
A-513	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₃
A-514	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-515	c-C ₃ H ₅	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-516	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-517	c-C ₃ H ₅	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-518	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-519	c-C ₃ H ₅	H	S	C(CH ₃) ₃
A-520	c-C ₃ H ₅	H	S	C(S)CH ₃
A-521	c-C ₃ H ₅	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-522	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	H
A-523	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₃
A-524	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-525	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-526	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-527	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-528	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-529	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-530	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-531	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-532	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-533	c-C ₅ H ₉	H	S	H
A-534	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-535	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₃
A-536	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-537	c-C ₅ H ₉	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-538	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-539	c-C ₅ H ₉	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-540	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-541	c-C ₅ H ₉	H	S	C(CH ₃) ₃
A-542	c-C ₅ H ₉	H	S	C(S)CH ₃
A-543	c-C ₅ H ₉	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-544	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	H
A-545	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₃
A-546	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-547	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-548	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-549	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-550	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-551	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-552	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-553	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-554	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-555	-CH ₂ CH ₂ -		S	H
A-556	CH ₂ CH ₂		S	CH ₃
A-557	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₃
A-558	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-559	CH ₂ CH ₂		S	CH(CH ₃) ₂
A-560	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-561	CH ₂ CH ₂		S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-562	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-563	CH ₂ CH ₂		S	C(CH ₃) ₃
A-564	CH ₂ CH ₂		S	C(S)CH ₃
A-565	CH ₂ CH ₂		S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-566	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	H
A-567	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₃
A-568	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₃
A-569	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-570	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH(CH ₃) ₂
A-571	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

73

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-572	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-573	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-574	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	C(CH ₃) ₃
A-575	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	C(S)CH ₃
A-576	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	C(S)CH ₂ CH ₃

Table B

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-1	CH ₃	H	O	OCH ₃
B-2	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-3	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-4	CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-5	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-6	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-7	CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-8	CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-9	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-10	CH ₃	H	O	NH ₂
B-11	CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-12	CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-13	CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-14	CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-15	CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-16	CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-17	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-18	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-19	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-20	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-21	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-22	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-23	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-24	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-25	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-26	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-27	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-28	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-29	CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)

34

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-30	CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-31	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₃
B-32	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₃
B-33	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-34	CH ₃	CH ₃	O	OCH(CH ₃) ₂
B-35	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-36	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-37	CH ₃	CH ₃	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-38	CH ₃	CH ₃	O	OC(CH ₃) ₃
B-39	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-40	CH ₃	CH ₃	O	NH ₂
B-41	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₃
B-42	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₂ CH ₃
B-43	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-44	CH ₃	CH ₃	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-45	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-46	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃) ₂
B-47	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-48	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-49	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-50	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-51	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-52	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-53	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-54	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-55	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-56	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-57	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-58	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-59	CH ₃	CH ₃	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-60	CH ₃	CH ₃	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-61	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-62	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-63	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-64	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-65	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-66	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂

75

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-67	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-68	CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-69	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-70	CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-71	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-72	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-73	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-74	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-75	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-76	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-77	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-78	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-79	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-80	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-81	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-82	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-83	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-84	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-85	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-86	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-87	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-88	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-89	CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-90	CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-91	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-92	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-93	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-94	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-95	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-96	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-97	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-98	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-99	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-100	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-101	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-102	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-103	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-104	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-105	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-106	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-107	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-108	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-109	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-110	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-111	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-112	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-113	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-114	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-115	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-116	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-118	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-119	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-120	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-121	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃
B-122	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-123	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-124	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-125	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-126	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-127	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-128	CH(CH ₃) ₂	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-129	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-130	CH(CH ₃) ₂	H	O	NH ₂
B-131	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₃
B-132	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-133	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-134	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-135	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-136	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃) ₂
B-137	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-138	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-139	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-140	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

77

No.	R ² -	R ³	Y	Z
B-141	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-142	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-143	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-144	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-145	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-146	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-147	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-148	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-149	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-150	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-151	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-152	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-153	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-154	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-155	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-156	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-157	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-158	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-159	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-160	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-161	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-162	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-163	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-164	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-165	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-166	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-167	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-168	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-169	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-170	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-171	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-172	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-173	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-174	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-175	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-176	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-177	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-178	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-179	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-180	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-181	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₃
B-182	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-183	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-184	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-185	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-186	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-187	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-188	C(CH ₃) ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-189	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-190	C(CH ₃) ₃	H	O	NH ₂
B-191	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₃
B-192	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-193	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-194	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-195	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-196	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-197	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-198	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-199	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-200	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-201	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-202	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-203	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-204	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-205	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-206	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-207	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-208	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-209	C(CH ₃) ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-210	C(CH ₃) ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-211	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-212	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-213	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-214	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂

No.	R ² -	R ³	Y	Z
B-215	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-216	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-217	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-218	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-219	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-220	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-221	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-222	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-223	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-224	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-225	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-226	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-227	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-228	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-229	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-230	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-231	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-232	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-233	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-234	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-235	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-236	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-237	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-238	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-239	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-240	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-241	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃
B-242	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-243	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-244	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-245	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-246	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-247	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-248	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-249	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-250	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NH ₂
B-251	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₃

80

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-252	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-253	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-254	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-255	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-256	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃) ₂
B-257	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-258	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-259	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-260	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-261	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-262	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-263	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-264	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-265	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-266	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-267	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-268	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-269	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-270	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)

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

10 The present invention further relates to the pharmaceutical use of the compounds of the formula I according to the invention and/or the pharmaceutically acceptable salts thereof, in particular to their use for treating tumors in mammals such as humans for example.

15 They are particularly important in plant protection 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 vegetables, rapeseed, sugar beet and fruit and rice,
- *Aphanomyces* species on sugar beet and vegetables,
- *Bipolaris* and *Drechslera* species on corn, cereals, rice and lawns,
- *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
- 5 • *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, ornamental plants and grapevines,
- *Bremia lactucae* on lettuce,
- *Cercospora* species on corn, soybean, rice and sugar beet,
- *Cochliobolus* species on corn, cereals, rice (e.g., *Cochliobolus sativus* on cereals,
- 10 *Cochliobolus miyabeanus* on rice),
- *Colletotricum* species on soybean and cotton
- *Drechslera* species on cereals and corn,
- *Exserohilum* species on corn,
- *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
- 15 • *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
- *Gaeumanomyces graminis* on cereals,
- *Gibberella* species on cereals and rice (e.g., *Gibberella fujikuroi* on rice),
- *Grainstaining complex* on rice,
- *Helminthosporium* species on corn and rice,
- 20 • *Microdochium nivale* on cereals,
- *Mycosphaerella* species on cereals, bananas and peanuts,
- *Phakopsara pachyrhizi* and *Phakopsara meibomia* on soybean,
- *Phomopsis* species on soybean and sunflowers,
- *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
- 25 • *Plasmopara viticola* on grapevines,
- *Podosphaera leucotricha* on apples,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* on cereals,
- *Pseudoperonospora* species on hops and cucurbits,
- *Puccinia* species on cereals and corn,
- 30 • *Pyrenophora* species on cereals,
- *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae* on rice,
- *Pyricularia grisea* on lawns and cereals
- *Pythium spp.* on lawns, rice, corn, cotton, rapeseed, sunflowers, sugar beet,
- 35 vegetables and other plants,
- *Rhizoctonia* species on cotton, rice, potatoes, lawns, corn, rapeseed, potatoes, sugar beet, vegetables and other plants,
- *Sclerotinia* species on rapeseed and sunflowers,
- *Septoria tritici* and *Stagonospora nodorum* on wheat,

- *Erysiphe* (syn. *Uncinula*) *necator* on grapevines,
- *Setosphaeria* species on corn and lawns,
- *Sphacelotheca reilina* on corn,
- *Thiëvaliopsis* species on soybean and cotton,
- 5 • *Tilletia* species on cereals,
- *Ustilago* species on cereals, corn and sugar beet, 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, for example dusting, coating or impregnation of seed, amounts of active compound of from 1 to 1000 g/100 kg of seed, preferably from 1 to 200 g/100 kg, in particular from 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 of the formula I can be present in various crystalline forms which likewise form part of the subject matter of the present invention.

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

Formulations for seed treatment may further comprise binders and/or gelants and if appropriate dyes.

- 5 Binders can be added to increase the adhesion of the active compounds to the seed after the treatment. Suitable binders are for example EO/PO block copolymer surfactants, but also polyvinyl alcohols, polyvinylpyrrolidones, polyacrylates, polymethacrylates, polybutenes, polyisobutylenes, polystyrenes, polyethyleneamines, polyethyleneamides, polyethyleneimines (Lupasol®, Polymin®), polyethers, 10 polyurethanes, polyvinyl acetates, Tylose and copolymers of these polymers. A suitable gelant is for example carrageen (Satiagel®).

The formulations are prepared in a known manner, for example by extending the active compound with solvents and/or carriers, if appropriate using emulsifiers and 15 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, 20 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 25 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, 30 dibutyl-naphthalenesulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ethers, furthermore condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and formaldehyde, polyoxyethylene octylphenol ether, ethoxylated isooctylphenol, 35 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,

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

- 10 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.

- 20 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).

- 25 For seed treatment, the formulations in question, when diluted from two- to ten-fold, produce active compound concentrations in the range from 0.01% to 60% by weight and preferably in the range from 0.1% to 40% by weight in the ready-to-use preparations.

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

A Water-soluble concentrates (SL, LS)

- 10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved with 90 parts by weight of water or with a water-soluble solvent. As an alternative, wetters or other auxiliaries are added. The active compound dissolves upon dilution with water. This gives a formulation having an active compound content of 10% by weight.

B Dispersible concentrates (DC)

- 20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in 70 parts by weight of cyclohexanone with addition of 10 parts by weight of a dispersant, for

85

example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion. The active compound concentration is 20% by weight.

C Emulsifiable concentrates (EC)

- 5 15 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in 75 parts by weight of xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5%). Dilution with water gives an emulsion. The formulation has an active compound content of 15% by weight.

10 **D Emulsions (EW, EO, ES)**

- 25 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in 35 parts by weight of xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5 parts by weight). This mixture is added to 30 parts by weight of water by means of an emulsifying machine (e.g. Ultraturrax) and made into a
15 homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion. The formulation has an active compound content of 25% by weight.

E Suspensions (SC, OD, FS)

- In an agitated ball mill, 20 parts by weight of a compound according to the invention are
20 comminuted with addition of 10 parts by weight of dispersants and wetters and 70 parts by weight of water or an organic solvent to give a fine active compound suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound. The active compound content in the formulation is 20% by weight.

25 **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 50 parts by weight of dispersants and wetters and made into water-dispersible or water-soluble granules by means of technical appliances (for example extrusion, spray tower, fluidized bed). Dilution with water gives a stable dispersion or
30 solution of the active compound. The formulation has an active compound content of 50% by weight.

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

- 75 parts by weight of a compound according to the invention are ground in a rotor-stator mill with addition of 25 parts by weight of dispersants, wetters and silica gel.
35 Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound. The active compound content of the formulation is 75% by weight.

H Gel formulations

- 40 20 parts by weight of a compound according to the invention, 10 parts by weight of

dispersant, 1 part by weight of gelant and 70 parts by weight of water or of an organic solvent are ball milled to form a fine suspension. Dilution with water gives a stable suspension having an active compound content of 20% by weight.

5 2. Products to be applied undiluted

I Dustable powders (DP, DS)

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

J Granules (GR, FG, GG, MG)

0.5 part by weight of a compound according to the invention is ground finely and associated with 99.5 parts by weight of carriers. Current methods are extrusion, spray-
15 drying or the fluidized bed. This gives granules with an active compound content of 0.5% by weight to be applied undiluted.

K ULV solutions (UL)

10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in 90 parts
20 by weight of an organic solvent, for example xylene. This gives a product with an active compound content of 10% by weight to be applied undiluted.

Seed treatment typically utilizes water-soluble concentrates (LS), suspensions (FS),
25 dusts (DS), water-dispersible and water-soluble powders (WS, SS), emulsions (ES), emulsifiable concentrates (EC) and gel formulations (GF). These formulations can be applied neat or preferably diluted to the seed. The application can take place prior to sowing.

Preference is given to using FS formulations for seed treatment. Such formulations
30 typically comprise from 1 to 800 g/l of active compound, from 1 to 200 g/l of surfactants, from 0 to 200 g/l of antifreeze, from 0 to 400 g/l of binder, from 0 to 200 g/l of dyes and solvent, preferably water.

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

Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions, pastes or oil dispersions, the substances, as such or dissolved in an oil or solvent, can be homogenized in water by means of a wetting agent, tackifier, dispersant or emulsifier. Alternatively, it is possible to prepare concentrates composed of active substance, wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

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

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

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

The compositions according to the invention can, in the use form as fungicides, also be present together with other active compounds, e.g. with herbicides, insecticides, growth regulators, fungicides or else with fertilizers. Mixing the compounds or the compositions comprising them in the application form as fungicides with further active compounds, in particular with other fungicides makes it possible in many cases to broaden the activity spectrum or prevent developments of resistance. Synergistic effects are obtained in many cases.

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

- acylalanines, such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace or oxadixyl,
- amine derivatives, such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamine or tridemorph,
- anilinopyrimidines, such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyprodinyl,
- antibiotics, such as cycloheximide, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin,

- azoles, such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinitroconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafole 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, mepronil, nuarimol, penthiopyrad, probenazole, proquinazid, pyrifenox, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole or triforine, N-(4'-bromobiphenyl-2-yl)-4-difluoromethyl-2-methylthiazole-5-carboxamide, N-(4'-trifluoromethylbiphenyl-2-yl)-4-difluoromethyl-2-methylthiazole-5-carboxamide, N-(4'-chloro-3'-fluorobiphenyl-2-yl)-4-difluoromethyl-2-methylthiazole-5-carboxamide, N-(3',4'-dichloro-4-fluorobiphenyl-2-yl)-3-difluoromethyl-1-methylpyrazole-4-carboxamide, N-(2-cyanophenyl)-3,4-dichloroisothiazole-5-carboxamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 2-butoxy-6-iodo-3-propylchromen-4-one, N-dimethyl-3-(3-bromo-6-fluoro-2-methylindole-1-sulfonyl)-[1,2,4]triazole-1-sulfonamide,
- 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, dazomet, diclomezine, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, phosphorous acid and its salts, iprovalicarb, hexachlorobenzene, mandipropamide, metrafenone, pencycuron, propamocarb, phthalide, tolclofos-methyl, quintozone or zoxamide, N-(2-(4-[3-(4-chlorophenyl)prop-2-ynyloxy]-3-methoxyphenyl)ethyl)-2-methanesulfonylamino-3-methylbutyramide, N-(2-(4-[3-(4-chlorophenyl)prop-2-ynyloxy]-3-methoxyphenyl)ethyl)-2-ethanesulfonylamino-3-methylbutyramide, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, methyl 3-(4-chlorophenyl)-3-(2-isopropoxycarbonylamino-3-methylbutyrylamino)propionate, 4-fluorophenyl N-(1-(1-(4-cyanophenyl)ethanesulfonyl)but-2-yl)carbamate,

- strobilurins, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin or trifloxystrobin,
- sulfenic acid derivatives, such as captafol, captan, dichlofluanid, folpet or tolylfluanid,
- cinnamides and analogous compounds, such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

Synthesis examples

10

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

15 Example 1 – Preparation of 2-[5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamino]butan-1-ol

1.57 mmol of triethylamine and 1.57 mmol of 2-aminobutan-1-ol were added to a solution of 500 mg (1.57 mmol) of 5,7-dichloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine in 4 ml of dichloromethane, and the solution was then stirred at 20 to 25°C for about 15 hours. The solution was then extracted with 0.5 M HCl and 5% strength NaCl solution. The organic phases were dried and freed from the solvent. What remained were 535 mg of the title compound as light-yellow crystals of m.p. 76-77°C.

25 ¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8.2 (1H, s); 6.85 (2H, q); 6.7 (1H, broad, NH); 3.85 (1H, s, broad); 3.7 (2H, q); 3.5 (1H, s, broad); 1.65 (1H, m); 1.55 (1H, m); 0.8 (3H, t).

Example 2 – Preparation of 2-[5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamino]butyl acetate

30

In each case 0.13 mmol of triethylamine, acetic anhydride and 4-N,N-dimethylaminopyridine were added to a solution of 50 mg (0.13 mmol) of 2-[5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamino]butan-1-ol (see Ex. 1) in 2 ml of dichloromethane. The solution was stirred at 20 to 25°C for about 5 hours. The solution was then extracted with 0.5 M HCl and 5% strength NaCl solution. The organic phases were dried and freed from the solvent. What remained were 36 mg of the title compound as light-yellow crystals of m.p. 39-42°C.

35

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8.4 (1H, s); 6.9 (2H, t); 6.4 (1H, broad, NH); 4.05 (2H, d); 3.7 (1H, broad); 2.0 (3H, s); 1.55 (2H, m); 0.85 (3H, t).

Example 3 – Preparation of [5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl]-(1-ethoxymethylpropyl)amine

0.05 mmol of caesium carbonate and 0.05 mmol of iodethane were added to a solution of 20 mg (0.05 mmol) of 2-[5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamino]butan-1-ol (see Ex. 1) in 1 ml of acetone, and the suspension was then stirred at 50°C for 2 hours. After addition of 5 ml of dichloromethane, the mixture was extracted with 0.5 M HCl and 5% strength NaCl solution. The organic phases were dried and freed from the solvent. What remained were 9 mg of the title compound as a colorless oil.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8.35 (1H, s); 6.85 (2H, m); 6.6 (1H, broad, NH); 3.5 (1H, broad); 3.45 (2H, q); 3.4 (2H, d); 1.65 (1H, m); 1.5 (1H, m); 1.1 (3H, t); 0.75 (3H, t).

The HPLC retention times (RT) in the tables below were determined at 40°C using the RP-18 column Chromolith Speed ROD (from Merck KGaA, Germany) using the mobile phase acetonitrile + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA)/water + 0.1% TFA in a gradient from 5:95 to 95:5 over 5 min. Mass spectrometry was carried out using quadropole electrospray ionization, 80 V (positive mode).

Compounds of the formula I.1:

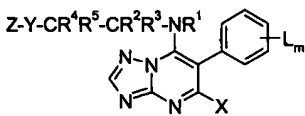


Table I

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm] .
I-1	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [386 M+H] ⁺
I-2	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.60 min; [400 M+H] ⁺
I-3	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.38 min; [385 M+H] ⁺
I-4	H	CH ₃	H	H	H	O	C(CH ₃) ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.85 min; [413 M+H] ⁺
I-5	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.90 min; [413 M+H] ⁺
I-6	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.65 min; [399 M+H] ⁺
I-7	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [385 M+H] ⁺
I-8	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.56 min; [398 M+H] ⁺
I-9	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.54 min; [410 M+H] ⁺
I-10	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.95 min; [385 M+H] ⁺
I-11	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.79 min; [371 M+H] ⁺
I-12	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.06 min; [419 M+H] ⁺
I-13	H	CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.56 min; [357 M+H] ⁺

57

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-14	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	C*R ² R ³ in S config. 166-168°C
I-15	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.81 min; [371 M+H] ⁺
I-16	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.01 min; [385 M+H] ⁺
I-17	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.13 min; [413 M+H] ⁺
I-18	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [427 M+H] ⁺
I-19	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.55 min; [441 M+H] ⁺
I-20	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.29 min; [427 M+H] ⁺
I-21	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.50 min; [441 M+H] ⁺
I-22	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.69 min; [455 M+H] ⁺
I-23	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.15 min; [413 M+H] ⁺
I-24	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.38 min; [427 M+H] ⁺
I-25	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.60 min; [441 M+H] ⁺
I-26	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.37 min; [461 M+H] ⁺
I-27	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.57 min; [475 M+H] ⁺
I-28	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.75 min; [489 M+H] ⁺
I-29	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	2.95 min; [399 M+H] ⁺
I-30	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.18 min; [413 M+H] ⁺
I-31	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.38 min; [427 M+H] ⁺

8

22

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-32	H	CH ₃	H	C ₆ H ₅	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.29 min; [433 M+H] ⁺
I-33	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	164-167°C
I-34	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.34 min; [427 M+H] ⁺
I-35	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.54 min; [441 M+H] ⁺
I-36	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [455 M+H] ⁺
I-37	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	72-74°C
I-38	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	78-81°C
I-39	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	70-73°C
I-40	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	3.03 min; [395 M+H] ⁺
I-41	H	CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	2.67 min; [367 M+H] ⁺
I-42	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	2.83 min; [381 M+H] ⁺
I-43	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	2.99 min; [383 M+H] ⁺
I-44	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	3.00 min; [383 M+H] ⁺
I-45	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	2.78 min; [369 M+H] ⁺
I-46	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	H	Cl	2-Cl,6-F	67-69°C
I-47	H	CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	76-79°C
I-48	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	80-82°C
I-49	H	CH ₃	H	H	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [416 M+H] ⁺
I-50	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	S	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.67 min; [416 M+H] ⁺

2

JP

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-51	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.45 min; [427 M+H] ⁺
I-52	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.70 min; [441 M+H] ⁺
I-53	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.92 min; [455 M+H] ⁺
I-54	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [447 M+H] ⁺
I-55	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.65 min; [475 M+H] ⁺
I-56	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.48 min; [463 M+H] ⁺
I-57	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.88 min; [469 M+H] ⁺
I-58	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)C(=CH ₂)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.67 min; [453 M+H] ⁺
I-59	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.59 min; [441 M+H] ⁺
I-60	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)C(=CH ₂)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [425 M+H] ⁺
I-61	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.74 min; [475 M+H] ⁺
I-62	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.48 min; [463 M+H] ⁺
I-63	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.06 min; [469 M+H] ⁺
I-64	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)C(=CH ₂)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.85 min; [453 M+H] ⁺
I-65	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.51 min; [441 M+H] ⁺
I-66	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [455 M+H] ⁺
I-67	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.90 min; [469 M+H] ⁺
I-68	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.83 min; [490 M+H] ⁺
I-69	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.66 min; [477 M+H] ⁺

8

if

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-70	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.06 min; [483 M+H] ⁺
I-71	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.99 min; [385 M+H] ⁺
I-72	H	CH ₃	CH ₃	H	H	S	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.77 min; [415 M+H] ⁺
I-73	H	CH ₃	CH ₃	H	H	S	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.57 min; [401 M+H] ⁺
I-74	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.39 min; [437 M+H] ⁺
I-75	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.60 min; [452 M+H] ⁺
I-76	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.80 min; [466 M+H] ⁺
I-77	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.36 min; [438 M+H] ⁺
I-78	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.57 min; [452 M+H] ⁺
I-79	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.77 min; [466 M+H] ⁺
I-80	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.24 min; [424 M+H] ⁺
I-81	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.46 min; [438 M+H] ⁺
I-82	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.65 min; [452 M+H] ⁺
I-83	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.48 min; [438 M+H] ⁺
I-84	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.71 min; [452 M+H] ⁺
I-85	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.91 min; [466 M+H] ⁺
I-86	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.02 min; [410 M+H] ⁺
I-87	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.24 min; [424 M+H] ⁺
I-88	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.45 min; [438 M+H] ⁺

2

2

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-89	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.19 min; [424 M+H] ⁺
I-90	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.42 min; [438 M+H] ⁺
I-91	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.62 min; [452 M+H] ⁺
I-92	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.35 min; [426 M+H] ⁺
I-93	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.56 min; [440 M+H] ⁺
I-94	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.76 min; [454 M+H] ⁺
I-95	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.33 min; [426 M+H] ⁺
I-96	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.53 min; [440 M+H] ⁺
I-97	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.73 min; [454 M+H] ⁺
I-98	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.17 min; [412 M+H] ⁺
I-99	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.41 min; [426 M+H] ⁺
I-100	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.61 min; [440 M+H] ⁺
I-101	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.43 min; [426 M+H] ⁺
I-102	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.67 min; [440 M+H] ⁺
I-103	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.91 min; [454 M+H] ⁺
I-104	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	2.95 min; [398 M+H] ⁺
I-105	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.18 min; [412 M+H] ⁺
I-106	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.40 min; [426 M+H] ⁺
I-107	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.14 min; [412 M+H] ⁺

64

Handwritten signature

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-108	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.36 min; [426 M+H] ⁺
I-109	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.57 min; [440 M+H] ⁺
I-110	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.68 min; [421 M+H] ⁺
I-111	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.66 min; [409 M+H] ⁺
I-112	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	3.29 min; [397 M+H] ⁺
I-113	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.76 min; [465 M+H] ⁺
I-114	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.93 min; [479 M+H] ⁺
I-115	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.71 min; [453 M+H] ⁺
I-116	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.89 min; [467 M+H] ⁺
I-117	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.37 min; [386 M+H] ⁺
I-118	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)C(CH ₃)=CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [425 M+H] ⁺
I-119	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.74 min; [476 M+H] ⁺
I-120	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.49 min; [463 M+H] ⁺
I-121	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.07 min; [469 M+H] ⁺
I-122	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)C(CH ₃)=CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.85 min; [453 M+H] ⁺
I-123	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.52 min; [441 M+H] ⁺
I-124	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.73 min; [455 M+H] ⁺
I-125	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.91 min; [469 M+H] ⁺
I-126	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.84 min; [490 M+H] ⁺

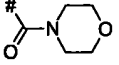
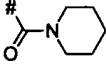
85

Handwritten signature

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-127	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.67 min; [477 M+H] ⁺
I-128	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.06 min; [483 M+H] ⁺
I-129	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)C(CH ₃)=CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.87 min; [467 M+H] ⁺
I-130	CH ₃	CH ₃	H	H	3-methylisoxazolidin-5-yl			Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [426 M+H] ⁺
I-131	H	CH ₃	H	H	H	O	C ₂ H ₅	Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [385 M+H] ⁺
I-132	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.50 min; [441 M+H] ⁺
I-133	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)C ₂ H ₅	Cl	2,4,6-F ₃	3.70 min; [455 M+H] ⁺
I-134	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.88 min; [469 M+H] ⁺
I-135	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.81 min; [489 M+H] ⁺
I-136	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.64 min; [477 M+H] ⁺
I-137	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.04 min; [483 M+H] ⁺
I-138	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.18 min; [399 M+H] ⁺
I-139	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	OCH ₃	2,4,6-F ₃	3.08 min; [395 M+H] ⁺
I-140	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	OCH ₃	2,4,6-F ₃	3.07 min; [395 M+H] ⁺
I-141	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	3.22 min; [398 M+H] ⁺
I-142	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.25 min; [410 M+H] ⁺
I-143	H	C(CH ₃) ₃	H	=O		O	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.56 min; [427 M+H] ⁺

88

[Handwritten signature]

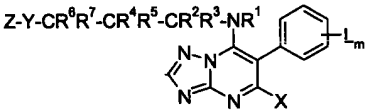
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-144	H	CH ₃	CH ₃	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	1,4 (6H); 3,4 (2H); 5,1 (1H); 6,5 (1H); 6,9 (2H); 8,35 (1H)
I-145	H	CH ₃	CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	2,4,6-F ₃	149-153°C
I-146	H	CF ₃	H	=O		O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.85 min; [425 M+H] ⁺
I-147	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)OCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.30 min; [457 M+H] ⁺
I-148	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)N(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.27 min; [470 M+H] ⁺
I-149	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	SO ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.22 min; [477 M+H] ⁺
I-150	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	205-208°C
I-151	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	O	H	CH ₃	2,4,6-F ₃	197-200°C
I-152	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)O(CH ₂) ₃ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.91 min; [499 M+H] ⁺
I-153	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)OCH ₂ CCl ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.94 min; [574 M+H] ⁺
I-154	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)O(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [485 M+H] ⁺
I-155	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O		Cl	2,4,6-F ₃	3.23 min; [512 M+H] ⁺
I-156	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)OCH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.54 min; [471 M+H] ⁺
I-157	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O		Cl	2,4,6-F ₃	3.70 min; [510 M+H] ⁺

99

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-158	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)N[CH(CH ₃)C ₂ H ₅] ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.26 min; [555 M+H] ⁺

denotes the bond to Y

Compounds of the formula I.2



68

Table II

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y	Z	X	L _m	phys. data HPLC (RT [min]; MS [m/z]); m.p. [°C]
II-1	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.59 min; [371 M+H] ⁺
II-2	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.04 min; [413 M+H] ⁺
II-3	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.07 min; [427 M+H] ⁺
II-4	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.45 min; [441 M+H] ⁺

100

Examples of the action-against harmful fungi

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

5

The active compounds were formulated separately as a stock solution with 0.25% by weight of active compound in acetone or DMSO. 1% by weight of the emulsifier Wettol EM 31 (wetting agent having emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkylphenols) was added to this solution. The stock solutions of the active compounds were diluted with water to the stated concentration.

10

Use example 1 - Activity against early blight of tomatoes caused by *Alternaria solani*

15

Leaves of potted plants of the cultivar "Golden Queen" were sprayed to run-off point with an aqueous suspension having the concentration of active compound stated below. The next day, the leaves were infected with an aqueous spore suspension of *Alternaria solani* in a 2% biomalt solution having a density of 0.17×10^8 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 %.

20

In this test, the plants which had in each case been treated with 250 ppm of the active compounds Nos. I-1 to I-7, I-9, I-14, I-16, I-20, I-21, I-22, I-25, I-29, I-33 to I-40, I-43 to I-46, I-55, I-56, I-57, I-65, I-66, I-73 to I-80, I-83, I-84 and I-95 to I-97 had an infection level of not more than 15%, whereas the untreated plants were 90% infected.

25

Use example 2 - Activity against net blotch of barley caused by *Pyrenophora teres*, 1 day protective application

30

Leaves of potted barley seedlings of the cultivar "Hanna" were sprayed to run-off point with an aqueous suspension having the concentration of active compounds stated below. 24 hours after the spray coating had dried on, the test plants were inoculated with an aqueous spore suspension of *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *teres*, the net blotch pathogen. The test plants were then placed in the greenhouse at temperatures between 20 and 24°C and 95 to 100% relative atmospheric humidity. After 6 days, the extent of the development of the disease was determined visually in % infection of the entire leaf area.

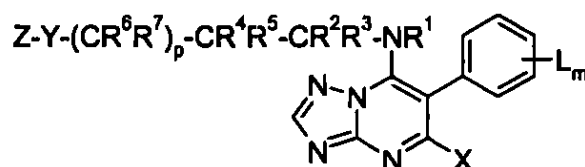
35

In this test, the plants which had in each case been treated with 250 ppm of the active compounds Nos. I-1, I-2, I-6 to I-11, I-14 to I-24, I-33 to I-40, I-44, I-45, I-55 to I-58, I-71, I-74, I-76 and I-77 showed an infection level of not more than 10%, whereas the untreated plants were 90% infected.

40

Claims

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are as defined below:

10 R^1 is hydrogen, C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halo-cycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15 R^2 is C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

20 R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 are hydrogen or one of the groups mentioned under R^2 ,

25 R^4 , together with R^3 or R^5 , may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a ;

30 R^2 with R^3 , R^4 with R^5 , R^6 with R^7 may in each case together, with formation of carbonyl groups, also be oxygen and, with formation of spiro groups, form a C_2 - C_5 -alkylene, or alkenylene or alkynylene chain which may be interrupted by one to three heteroatoms from the group consisting of O, N and S;

35 R^1 to R^7 may in each case carry one to four identical or different groups R^a :

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -haloalkoxy,

5 C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-alkylthio, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-haloalkenyloxy, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-alkynyloxy, C₃-C₈-haloalkynyloxy, C₃-C₈-cycloalkoxy, C₃-C₈-cycloalkenyloxy, oxy-C₁-C₃-alkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a 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,

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

15 R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxy, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals comprise 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals comprise 2 to 8 carbon atoms;

25 and/or one to three of the following radicals:

30 cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclyloxy, where the cyclic systems comprise 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C₁-C₈-alkoxy, aryl-C₁-C₈-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably comprise 6 to 10 ring members and the hetaryl radicals 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

35 p is zero or 1;

L is halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, cyano, nitro, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino, C₁-C₄-alkylcarbonylamino, C(O)-R, S(O)_n-R;

40 R is hydrogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy,

104

C₂-C₄-alkynyloxy, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino; where the groups R may be substituted by one to three groups R^b;

5

n is zero, 1 or 2;

m is 1, 2, 3, 4 or 5;

10

X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy, C₂-C₄-alkynyloxy or C₁-C₂-haloalkoxy,

Y is oxygen or sulfur;

15

Z is hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₈-alkyl-carbonyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alkenyloxycarbonyl, C₃-C₈-alkynyloxycarbonyl, C₃-C₈-cycloalkylcarbonyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-cycloalkoxycarbonyl, C₃-C₈-cycloalkenyloxycarbonyl, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-alkylthio, C₁-C₈-alkylsulfonyl, phenyl, naphthyl, a 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; or

20

25

Z together with R⁵ or R⁷ may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms and Y, may comprise one or two further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a;

30

the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b;

35

R^A, R^B are independently hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl or C₃-C₈-cycloalkenyl;

R^A and R^B may combine with the nitrogen atom to which they are attached to form a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic ring which, as well as carbon atoms, may comprise from one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as a ring member and/or may carry one or more substituents R^a.

2. The compound of the formula I according to claim 1 in which the substituents are as defined below:

- 5 R^1 is hydrogen, C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- 10 R^2 is C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle
- 15 which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 are hydrogen or one of the groups mentioned under R^2 ,
- 20 R^4 , together with R^3 or R^6 , may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a ;
- 25 R^2 with R^3 , R^4 with R^5 , R^6 with R^7 may in each case together, with formation of spiro groups, form a C_2 - C_8 -alkylene, or alkenylene or alkynylene chain which may be interrupted by one to three heteroatoms from the group consisting of O, N and S;
- 30 R^1 to R^7 may in each case carry one to four identical or different groups R^a according to claim 1;
- 35 Z is hydrogen, C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_3 - C_8 -cycloalkylcarbonyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl, phenyl, naphthyl, a 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; or
- 40 Z together with R^4 or R^6 may also form a five- or six-membered saturated or

unsaturated ring which, in addition to carbon atoms and Y, may comprise one or two further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a;

5 the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b according to claim 1.

3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which X is chlorine or methyl, in particular chlorine.

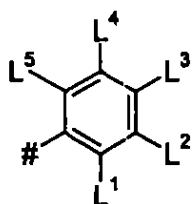
10

4. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 3 in which the index p is zero.

15

5. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 4 in which at least one group L is located in the ortho-position to the point of attachment to the triazolopyrimidine skeleton.

6. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 5 in which the phenyl group substituted by L_m is the group A



A

20

in which # is the point of attachment to the triazolopyrimidine skeleton and

L¹ is fluorine, chlorine, CH₃ or CF₃;

L², L⁴ independently of one another are hydrogen or fluorine;

25 L³ is hydrogen, fluorine, chlorine, CN, CH₃, OCH₃, NH₂, NHCH₃, N(CH₃)₂, C(O)NH₂ or C(O)CH₃; and

L⁵ is hydrogen, fluorine, chlorine or CH₃.

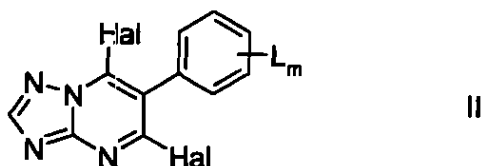
30

7. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 6 in which the phenyl group substituted by L_m is one of the combinations of substituents below:
2-fluoro-6-chloro, 2,6-difluoro, 2,6-dichloro, 2-fluoro-6-methyl, 2,4,6-trifluoro,
2,6-difluoro-4-methoxy, 2-chloro-4-methoxy, pentafluoro, 2-methyl-4-fluoro,
2-trifluoromethyl, 2-methoxy-6-fluoro, 2-chloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro,
2-fluoro-4-chloro, 2-chloro-4-fluoro, 2-chloro-5-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro,
35 2,3,4-trifluoro, 2-methyl, 2,4-dimethyl, 2-methyl-4-chloro, 2-methyl-5-fluoro,
2-fluoro-4-methyl, 2,6-dimethyl, 2,4,6-trimethyl, 2,6-difluoro-4-methyl,

107

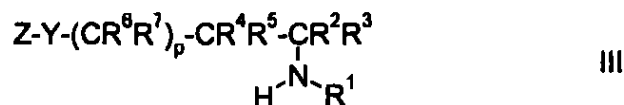
2-trifluoromethyl-4-fluoro, 2-trifluoromethyl-5-fluoro or 2-trifluoromethyl-5-chloro.

8. A process for preparing a compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which X is halogen by reacting dihalotriazolopyrimidines of the formula II,



5

in which the variables are as defined for formula I and Hal is a halogen atom, in particular chlorine, with amines of the formula III.



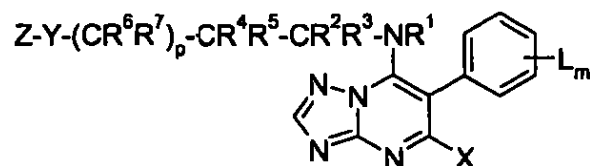
9. The process according to claim 8 in which Z is hydrogen.
10. A composition suitable for controlling harmful fungi, which composition comprises a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to claim 1 or 2.
11. The composition according to claim 10 which, as well as a compound of the formula I, additionally comprises a further active compound.
12. 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.
13. Seed comprising a compound of the formula I in an amount from 1 to 1000 g per 100 kg.

6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines, processes for their preparation, and their use for controlling harmful fungi, and also compositions comprising them

Abstract

5

6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are as defined below:

- R¹** is hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- R²** is alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷** are hydrogen or one of the groups mentioned under R², R⁴, together with R³ or R⁶, may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members; R² with R³, R⁴ with R⁵, R⁶ with R⁷ may in each case together, with formation of spiro groups, also form a C₂-C₅-alkylene, or alkenylene or alkynylene chain which may be interrupted by one to three heteroatoms from the group consisting of O, N and S;
- p** is zero or 1;
- L** is halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, cyano, nitro, amino, alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonylamino, C(O)-R, S(O)_n-R; where n is zero, 1 or 2;
- R** is hydrogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, amino, alkylamino, dialkylamino;
- m** is 1, 2, 3, 4 or 5;
- X** is halogen, cyano, alkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy or haloalkoxy;
- Y** is oxygen or sulfur;
- Z** is hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, alkylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, phenyl, naphthyl, a 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; or



5

Z together with R⁴ or R⁶ may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms and Y, may comprise one or two further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members the groups R¹ to R⁷, Z and R may be substituted according to the description;

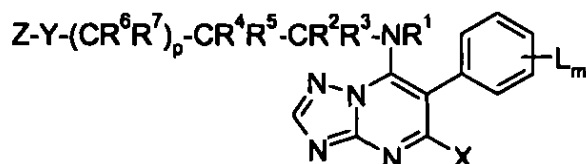
processes for preparing these compounds, compositions comprising them and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

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

Descripción

5

La presente invención se refiere a 6-fenil-7-amino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 R^1 significa hidrógeno, C_1 - C_{12} -alquilo, C_1 - C_{12} -halógenoalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquilo, C_2 - C_{12} -alquenilo, C_2 - C_{12} -halógenoalquenilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquenilo, C_2 - C_{12} -alquinilo, C_2 - C_{12} -halógenoalquinilo o fenilo, 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 R^2 significa C_1 - C_8 -alquilo, C_1 - C_8 -halógenoalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquilo, C_2 - C_8 -alquenilo, C_2 - C_8 -halógenoalquenilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquenilo, C_2 - C_8 -alquinilo, C_2 - C_8 -halógenoalquinilo
- 20 o fenilo, 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,

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 significan hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R^2 ,

5 R^4 también puede formar con R^3 o R^6 un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a ;

10 R^2 con R^3 , R^4 con R^5 , R^6 con R^7 también pueden significar juntos oxígeno para la formación de grupos carbonilo y formar una cadena de C_2-C_5 -alquileo o alqueni- leno, alquinileno para la formación de grupos espiro, que puede estar interrumpi- da por uno a tres heteroátomos del grupo O, N y S;

R^1 a R^7 pueden llevar cada vez uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes:

15 R^a significa halógeno, ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 - halógenoalquilo, C_1-C_6 -alquilcarbonilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -halógenoalcoxi, C_1-C_6 -alcoxycarbonilo, C_1-C_6 -alquiltio, C_1-C_6 -alquilamino, di- C_1-C_6 -alquilamino, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 - halógenoalquenilo, C_3-C_6 -cicloalquenilo, C_2-C_6 -alqueniloxi, C_3-C_6 - halógenoalqueniloxi, C_2-C_6 -alquinilo, C_2-C_6 -halógenoalquinilo, C_3-C_6 - alquiniloxi, C_3-C_6 -halógenoalquiniloxi, C_3-C_6 -cicloalcoxi, C_3-C_6 -ciclo- alqueniloxi, oxi- C_1-C_3 -alquilenoxi, fenilo, naftilo, un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que con- tiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

25

112

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

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

y/o uno a tres de los radicales siguientes:

15 cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterocicililoxi, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros de anillo; arilo, ariloxi, ariltio, aril-C₁-C₆-alcoxi, aril-C₁-C₆-alquilo, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10
20 miembros de anillo, y los radicales hetarilo contener 5 ó 6 miembros de anillo, pudiendo los sistemas cíclicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo;

p es cero ó 1;

25

- L significa halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, ciano, nitró, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino, C₁-C₄-alquilcarbonilamino, C(O)-R, S(O)_n-R;
- 5 R significa hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino; pudiendo los grupos R estar sustituidos por uno a tres grupos R^b;
- n es cero, 1 ó 2;
- 10 m es 1, 2, 3, 4 ó 5;
- X significa halógeno, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi o C₁-C₂-halógenoalcoxi,
- 15 Y es oxígeno o azufre;
- Z significa hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₈-alquil-carbonilo, C₁-C₈-alcoxycarbonilo, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alqueniloxicarbonilo, C₃-C₈-alquiniloxicarbonilo, C₃-C₈-cicloalquilcarbonilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo, C₃-C₈-cicloalcoxycarbonilo, C₃-C₈-cicloalqueniloxicarbonilo, C₁-C₈-alquilsulfinilo, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₈-alquilsulfonilo, fenilo, 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; o

Z también puede formar con R⁵ o R⁷ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono e Y puede llevar uno o dos heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

5

el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b;

10

R^A, R^B significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalquenilo;

15

R^A y R^B pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a.

20

Además, la invención se refiere a procedimientos y productos intermedios para la preparación de estos compuestos, a productos que los contienen, así como al uso de los mismos para combatir hongos nocivos fitopatógenos.

De la EP-A 71 792 se conocen 6-fenil-7-amino-triazolopirimidinas en términos generales. 6-fenil-7-amino-triazolopirimidinas con grupos hidroxilo o grupos éter, que contienen sustituyentes 7-amino se divulgan en la EP-A 550 113, US 5 993 996, US 6 117 865,

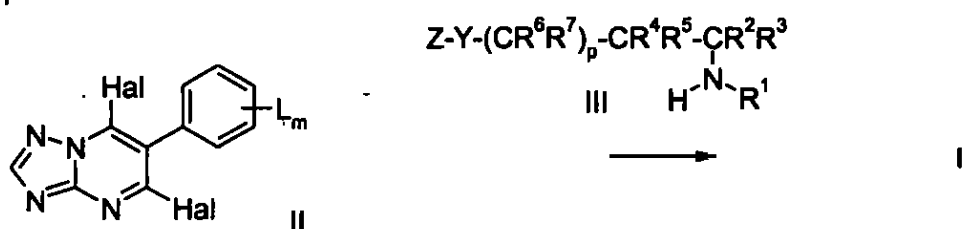
US 6 297 251 y WO 98/46607. Estos compuestos son conocidos para controlar hongos nocivos.

Los compuestos según la invención se distinguen de los compuestos divulgados en las publicaciones arriba indicadas en la estructura especial del grupo 7-amino, que en el átomo de α -carbono presenta una ramificación.

El efecto de los compuestos conocidos es en muchos casos insatisfactorio. Partiendo de ello, la presente invención tiene el objeto de proveer compuestos con efecto mejorado y/o espectro de acción más amplio.

Por tanto, se encontraron los compuestos definidos al comienzo. Además, se encontraron procedimientos y productos intermedios para su preparación, productos que los contienen, así como el procedimientos para combatir hongos nocivos usando los compuestos I.

Los compuestos según la invención se pueden obtener mediante diferentes métodos. Ventajosamente, se obtienen por reacción de 7-dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula II con aminas de la fórmula III, donde las variables tienen las definiciones indicadas para la fórmula I.



Esta reacción se realiza, preferentemente, a 0°C a 70°C, preferentemente, 10°C a 35°C, preferentemente en presencia de un disolvente inerte, como p.ej. un éter, tal como dioxano, éter dietílico o, especialmente, tetrahidrofurano, un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano y un hidrocarburo aromático, tal como tolueno [ver

5 WO-A 98/46608].

Es preferible usar una base, por ejemplo, una amina terciaria, tal como tritetilamina o una amina inorgánica, tal como carbonato de potasio. También se puede usar amina

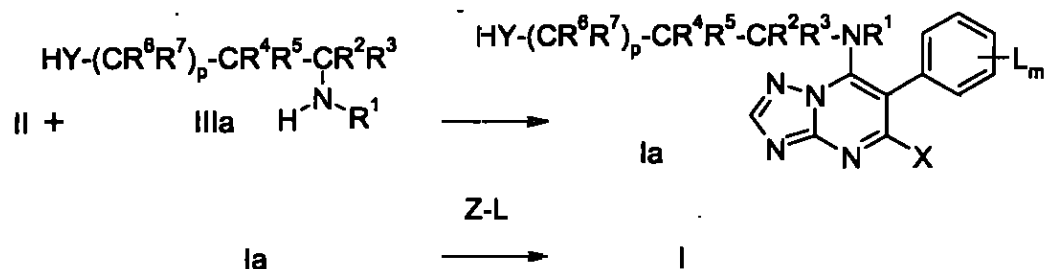
excesiva la fórmula III como base.

10

Usando las 5,7-dihalógenotriazolopirimidinas conocidas de la EP-A 550 113 y EP-A 770 615 se pueden preparar las 5-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula I, donde X significa halógeno, preferentemente, cloro. Son un objeto preferido de la presente invención. Otras 5,7-dihalógenotriazolopirimidinas se pueden preparar en analogía a la

15 literatura citada.

Dependiendo de la configuración del grupo Z en la fórmula I, puede ser ventajosa la reacción de II con una correspondiente hidroxí- o bien mercaptoamina (Z = hidrógeno) de la fórmula IIIa y se puede introducir el grupo Z en la etapa de la 7-hidroxí-, o bien 7-
20 mercaptoaminotriazolopirimidina de la fórmula Ia mediante eterificación o esterificación.

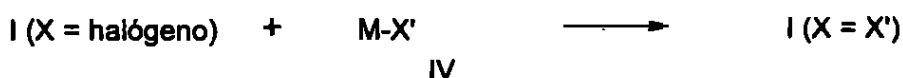


Para tal fin, se hace reaccionar la 7-hidroxi-, o bien mercaptoaminotriazolopirimidina de la fórmula Ia con un agente de alquilación o de acilación Z-L, donde L significa un grupo disociable nucleófilo. Las condiciones de reacción apropiadas para una eterificación o esterificación son generalmente conocidas al perito [ver: Organikum, VEB

5 Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin (1981)].

Aminas de las fórmulas III y IIIa se conocen de la literatura, pueden ser preparadas mediante métodos conocidos o se obtienen en el comercio.

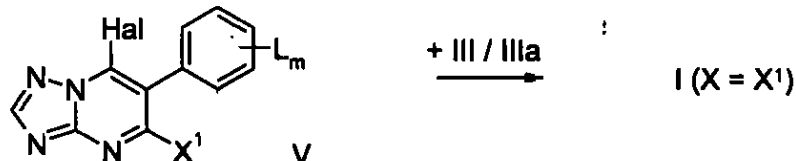
- 10 Compuestos de la fórmula I, en la que X significa ciano, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₂-halógenoalcoxi, se pueden preparar, ventajosamente, transformando compuestos I, donde X es halógeno, preferentemente, cloro, con compuestos M-X' (fórmula IV). Los compuestos IV son, dependiendo del significado del grupo X' a incorporar, un alcóxido o un halógenoalcóxido. La reacción se efectúa, ventajosamente, en presencia de
- 15 un disolvente inerte. El catión M en la fórmula IV tiene poca importancia; pero por razones prácticas se prefieren las sales de amonio, tetraalquilamonio o las sales de metal alcalino o alcalinotérreo.



- 20 Generalmente, la temperatura de reacción varía de 0 a 120°C., preferentemente, de 10 a 40°C [ver J. Heterocycl. Chem., Vol.12, p. 861-863 (1975)].

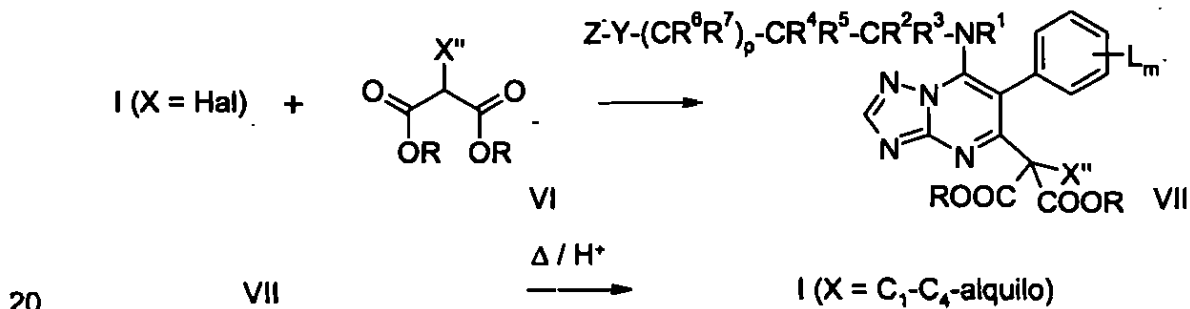
Disolventes apropiados son los éteres, tales como dioxano, éter dietílico y, preferentemente, tetrahidrofurano, hidrocarburos halogenados, como p.ej. diclorometano o hidrocarburos aromáticos, p.ej. tolueno.

- 5 Compuestos de la fórmula I, en los que X significa C₁-C₄-alquilo, se pueden preparar, ventajosamente, mediante el siguiente método de síntesis:



- La reacción de las 5-alkil-7-halogenotriazolopirimidinas de la fórmula V, donde X¹ significa C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-halógenoalquilo, con las aminas III o IIIa, se realiza
- 10 bajo las condiciones descritas más arriba. Los compuestos de la fórmula V se conocen de la WO 03/093271 o pueden ser preparadas según la literatura allí citada.

- Los compuestos de la fórmula I, donde X significa C₁-C₄-alquilo, se pueden preparar, alternativamente, a partir de compuestos I, en los que X significa, especialmente, cloro,
- 15 y malonatos de la fórmula VI. En la fórmula VI, X" significa hidrógeno o C₁-C₃-alquilo y R significa C₁-C₄-alquilo. Son transformados en compuestos de la fórmula VII y descarboxilados en compuestos I [ver US 5,994,360].



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

- 5 La subsiguiente saponificación del éster VII se realiza bajo las condiciones habituales; en función de los diferentes elementos puede ser ventajosa una saponificación ácida o una saponificación alcalina de los compuestos VII. Bajo las condiciones de la saponificación de éster ya se puede efectuar la descarboxilación dando I completa o parcialmente.

10

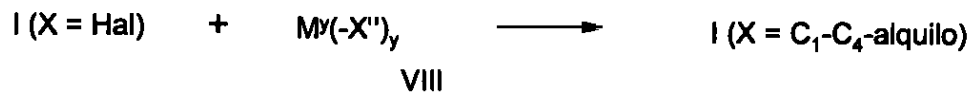
La descarboxilación se efectúa a temperaturas de 20°C a 180°C, preferentemente, 50°C a 120°C, en un disolvente inerte, opcionalmente, en presencia de un ácido.

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

25

Compuestos de la fórmula I, en los que X significa C₁-C₄-alquilo se pueden preparar también por acoplamiento de 5-halógenotriazolopirimidinas de la fórmula I con reactivos de metal orgánico de la fórmula VIII. En una variante de este procedimiento se realiza la reacción bajo catálisis de un metal transitorio, como p.ej Ni o Pd.

5



En la fórmula VIII, M representa un ión de metal de la valencia Y, como por ejemplo B, Zn o Sn y X'' significa C₁-C₃-alquilo. Esta reacción se puede realizar, por ejemplo, mediante los siguientes métodos: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Vol. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Vol. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Vol. 34, 8267 (1993); loc. cit. Vol. 33, 413 (1992).

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

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

25

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. Transformaciones correspondientes pueden tener lugar también en la aplicación, por ejemplo, en la planta misma o en el hongo nocivo a combatir cuando estos son tratados.

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

10

halógeno: fluoro, cloro, bromo e yodo;

alquilo: radicales hidrocarburo ramificados o lineales saturados con 1 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono, p.ej. alquilo C₁-C₈, tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

20

halógenoalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 2, 4 ó 6 átomos de carbono (como los arriba mencionados), donde los átomos de hidrógeno están parcial o completamente sustituidos por átomos de halógeno, como los arriba mencionados, especialmente, C₁-C₂-halógenoalquilo, tales como clorometilo, bromometilo, diclorome-

25

122

tilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, dicloro-
fluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo,
2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-
dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo o 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

- 5 alquenilo: radicales hidrocarburo no saturados o lineales o ramificados con 2 a 4, 6 ó 8
átomos de carbono y uno o dos dobles enlaces en una posición arbitraria, como por
ejemplo. C₂-C₈-alquenilo, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-
butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-
propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-
10 metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-but-
enilo, 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-1propenilo, 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-
15 pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-
pentenilo, 2-metil-3pentenilo, 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,
20 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-
butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo,
1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-
propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-
propenilo;

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

alquinilo: grupos hidrocarburo lineales o ramificados con 2 a 4, 6 ó 8 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en una posición arbitraria, por ejemplo, C_2-C_6 -alquinilo, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

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, ciclo-pentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo;

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

- heterocíclico 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-tetrahidrofurano, 3-tetrahidrofurano, 2-tetrahidrotieno, 3-tetrahidrotieno, 2-pirrolidino, 3-pirrolidino, 3-isoxazolidino, 4-isoxazolidino, 5-isoxazolidino, 3-isotiazolidino, 4-isotiazolidino, 5-isotiazolidino, 3-pirazolidino, 4-pirazolidino, 5-pirazolidino, 2-oxazolidino, 4-oxazolidino, 5-oxazolidino, 2-tiazolidino, 4-tiazolidino, 5-tiazolidino, 2-imidazolidino, 4-imidazolidino, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-piperidino, 3-piperidino, 4-piperidino, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropirano, 4-tetrahidropirano, 2-tetrahidrotieno, 3-hexahidropiridacino, 4-hexahidropiridacino, 2-hexahidropirimidino, 4-hexahidropirimidino, 5-hexahidropirimidino y 2-piperacino;
- 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 pueden contener uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros de anillo, 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 de anillo, p.ej. 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridacino, 4-piridacino, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-piracino;

alquileno: cadenas divalentes no ramificadas a partir de 3 a 5 grupos CH_2 , p.ej. CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ y $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$;

oxialquileo: cadenas divalentes no ramificadas a partir de 2 a 4 grupos CH_2 , estando
5 una valencia ligada por medio de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p.ej.
 OCH_2CH_2 , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$;

oxialquilenoxi: cadenas divalentes no ramificadas a partir de 1 a 3 grupos CH_2 , estando
ambas valencias ligadas por medio de un átomo de oxígeno con el esqueleto, p.ej. ,
10 OCH_2O , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$;

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.

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

Se prefieren los compuestos I, en los que R^1 significa hidrógeno o C_1 - C_4 -alquilo, por
20 ejemplo, hidrógeno o metilo o etilo, especialmente, hidrógeno.

Además, son preferidos los compuestos I, en los que R^2 significa C_1 - C_8 -alquilo o C_3 - C_8 -cicloalquilo, especialmente, C_1 - C_6 -alquilo o C_3 - C_6 -cicloalquilo, preferentemente, metilo, etilo, iso-propilo, iso-butilo, terc. butilo, sec. pentilo, ciclopropilo o ciclopentilo,
25 especialmente, terc. butilo.

También son preferidos los compuestos I, en los R^3 significa hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo o C_3-C_6 -cicloalquilo, especialmente, hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo o C_3-C_6 -cicloalquilo, preferentemente, hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo o isopropilo.

- 5 Si R^3 es un grupo alquilo, entonces R^3 tiene, preferentemente, el mismo significado que R^2 .

En otra modalidad de los compuestos de la fórmula I, R^2 y R^3 forman juntos un grupo C_3-C_6 -alquilenos, especialmente, un grupo C_3-C_4 -alquilenos.

10

En otra modalidad de los compuestos de la fórmula I, R^4 , R^5 , R^6 y R^7 significan cada vez hidrógeno o C_1-C_4 -alquilo, especialmente, hidrógeno, metilo o etilo, especialmente, hidrógeno.

- 15 En otra modalidad de los compuestos de la fórmula I, R^4 y R^5 y/o R^6 y R^7 forman cada vez juntos un grupo C_3-C_6 -alquilenos-, C_3-C_6 -oxialquilenos o C_2-C_6 -oxialquilenoxi, especialmente un grupo C_3-C_4 -alquilenos.

- 20 En una modalidad preferida de los compuestos de la fórmula I, el índice p tiene el valor cero.

En otra modalidad preferida de los compuestos de la fórmula I, Y significa oxígeno.

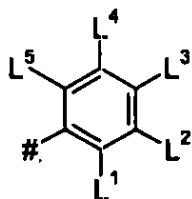
- 25 En otra modalidad de los compuestos de la fórmula I, Z representa un grupo monovalente.

En una modalidad preferida de los compuestos de la fórmula I, Z significa C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-alquilcarbonilo, especialmente, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, acetilo, propan-1-ona o butan-1-ona.

- 5 Son preferidos los compuestos I, en los que X significa halógeno, C₁-C₄-alquilo, ciano o C₁-C₄-alcoxi, como p.ej. cloro, bromo, metilo, ciano, metoxi o etoxi, especialmente, cloro.

- En una modalidad preferida de los compuestos I, por lo menos un grupo L se encuentra en la posición orto con respecto al esqueleto de trazolopirimidina, especialmente, cloro, flúor o metilo.
- 10

Además, se prefieren, especialmente, los compuestos I, en los que el grupo fenilo sustituido por L_m representa el grupo A



A

15

donde # representa el lugar de enlace con el esqueleto de trazolopirimidina y

L¹ significa flúor, cloro, CH₃ o CF₃;

L², L⁴ significan, independientemente, hidrógeno o flúor;

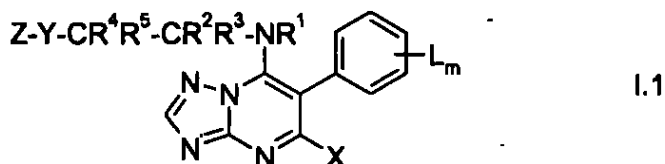
L³ significa hidrógeno, flúor, cloro, CN, CH₃, OCH₃, NH₂, NHCH₃, N(CH₃)₂,

- 20 C(O)NH₂ o C(O)CH₃; y

L⁵ significa hidrógeno, flúor, cloro o CH₃.

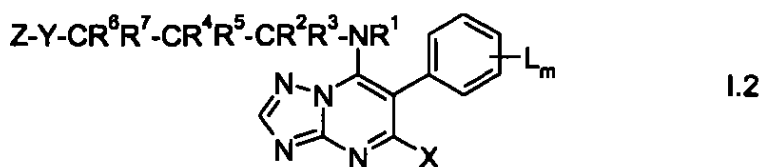
Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que L_m representa una de las siguientes combinaciones de sustitución: 2-fluoro-6-cloro, 2,6-difluoro, 2,6-dicloro, 2-fluoro-6-metilo, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-metoxi, 2-cloro-4-metoxi, pentafluoro, 2-metil-4-fluoro, 2-trifluorometilo, 2-metoxi-6-fluoro, 2-cloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-cloro, 2-cloro-4-fluoro, 2-cloro-5-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-metilo, 2,4-dimetilo, 2-metil-4-cloro, 2-metil-5-fluoro, 2-fluoro-4-metilo, 2,6-dimetilo, 2,4,6-trimetilo, 2,6-difluoro-4-metilo, 2-trifluorometil-4-fluoro, 2-trifluorometil-5-fluoro ó 2-trifluorometil-5-cloro.

10 Otra variante preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I.1:



en la que las variables tienen las definiciones arriba indicadas.

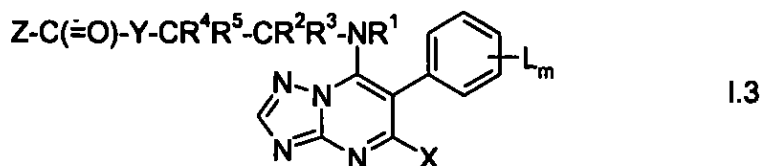
15 Otra variante de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I.2,



en la que las variables tienen las definiciones arriba indicadas.

Otra variante de la invención se refiere a compuestos de las fórmulas I y I.1, en las que
20 Z representa un grupo ligado por medio de un grupo carbonilo.

Estos compuestos corresponden, especialmente a la fórmula I.3:



donde las variables tienen los significados indicados en la fórmula I y Z tiene los siguientes significados:

- 5 hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-alcoxi, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-alquenilo, C₃-C₈-alquinoxio, C₃-C₈-cicloalcoxi, C₃-C₈-cicloalquinoxio, NR^AR^B, un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S; el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b.

10

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

15

Además de los compuestos mencionados en las Tablas 1 a 64, también los correspondientes derivados, en los que X significa ciano, metilo o metoxi, son objetos preferidos.

20 Tabla 1

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-6-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-dicloro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-6-metil y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 5

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4,6-trifluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 6

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metoxi y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa pentafluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-4-fluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 10

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metoxi-6-fluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 12

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 13

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4-difluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-4-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,3-difluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,5-difluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,3,4-trifluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 20

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4-dimetilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 21

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-4-cloro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 22

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-4-metilo y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-dimetilo y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4,6-trimetilo y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metilo y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 26

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-4-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 27

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 28

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 29

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 30

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-5-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 31

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-5-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 32

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-metoxi y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 33

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-6-cloro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 34

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 35

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-dicloro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 36

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-6-metilo y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 37

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4,6-trifluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metoxi y significa R¹ metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 39

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa pentafluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 40

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-4-fluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 41

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometilo y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 42

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metoxi-6-fluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 43

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 44

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 45

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4-difluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 46

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-4-cloro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 47

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 48

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,3-difluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 49

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,5-difluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 50

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,3,4-trifluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 51

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metilo y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 52

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4-dimetilo y R^1 metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 53

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-4-cloro y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 54

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-4-metilo y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 55

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-dimetilo y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 56

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4,6-trimetilo y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 57

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metil y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 58

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-4-fluoro y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 59

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-fluoro y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 60

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-cloro y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

20

Tabla 61

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y R^1 significa metilo, R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

25

Tabla 62

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-5-fluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

5

Tabla 63

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-5-fluoro y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

10

Tabla 64

Compuestos de la fórmula I.1, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-metoxi y R¹ significa metilo, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A

15

Tabla 65

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-6-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 66

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

25

Tabla 67

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-dicloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

5

Tabla 68

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-6-metil y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

10

Tabla 69

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4,6-trifluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

15

Tabla 70

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metoxi y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 71

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa pentafluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

25

Tabla 72

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-4-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

5

Tabla 73

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometilo y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

10

Tabla 74

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metoxi-6-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

15

Tabla 75

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 76

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

25

Tabla 77

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4-difluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

5

Tabla 78

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-4-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

10

Tabla 79

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

15

Tabla 80

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,3-difluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 81

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,5-difluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

25

Tabla 82

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,3,4-trifluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

5

Tabla 83

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

10

Tabla 84

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4-dimetilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

15

Tabla 85

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-4-cloro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 86

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-fluoro-4-metilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

25

Tabla 87

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-dimetilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

5

Tabla 88

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,4,6-trimetilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

10

Tabla 89

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2,6-difluoro-4-metilo y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

15

Tabla 90

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-4-fluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 91

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-fluoro y R^1 , R^4 y R^5 significan hidrógeno y la combinación de R^2 , R^3 , Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

25

Tabla 92

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-trifluorometil-5-cloro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

5

Tabla 93

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

10

Tabla 94

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-5-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

15

Tabla 95

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-metil-5-fluoro y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla B

20

Tabla 96

Compuestos de la fórmula I.3, en los que X significa cloro, L_m significa 2-cloro-4-metoxi y R¹, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno y la combinación de R², R³, Y y Z representa un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla

25

Tabla.A

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-1	CH ₃	H	O	H
A-2	CH ₃	H	O	CH ₃
A-3	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-5	CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₃	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-8	CH ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-9	CH ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-10	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-11	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-12	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-15	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-16	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-17	CH ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-18	CH ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-19	CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-20	CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-21	CH ₃	H	O	C(O)(4-piridyl)
A-22	CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-23	CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-24	CH ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-25	CH ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-26	CH ₃	CH ₃	O	H
A-27	CH ₃	CH ₃	O	CH ₃
A-28	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-29	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-30	CH ₃	CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-31	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-32	CH ₃	CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-33	CH ₃	CH ₃	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-34	CH ₃	CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-35	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-36	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃

150

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-37	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-38	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-39	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-40	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-41	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-42	CH ₃	CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-43	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-44	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-45	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-46	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-piridyl)
A-47	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-48	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-49	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-50	CH ₃	CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-51	CH ₂ CH ₃	H	O	H
A-52	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃
A-53	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-54	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-55	CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-56	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-57	CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-58	CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-59	CH ₂ CH ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-60	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-61	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-62	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-64	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-65	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-66	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-67	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-68	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-69	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-70	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-71	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-piridyl)
A-72	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-73	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-74	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-75	CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-76	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	H
A-77	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₃
A-78	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-80	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-81	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-82	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-83	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-84	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-85	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-86	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-87	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-88	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-89	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-90	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-91	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-92	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-93	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-94	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-95	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-96	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-piridilo)
A-97	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-98	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-99	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-100	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-101	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	H
A-102	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃
A-103	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-104	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-105	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-106	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-107	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-108	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-109	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-110	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-111	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-112	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-113	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-114	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-115	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-116	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-118	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-119	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-120	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-121	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-piridyl)
A-122	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-123	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-124	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-125	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-126	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	H
A-127	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₃
A-128	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-129	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-130	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-131	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-132	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-133	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-134	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-135	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-136	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-137	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-138	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-139	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-140	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-141	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-142	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-143	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-144	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-145	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-146	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-piridilo)
A-147	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-148	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-149	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-150	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-151	CH(CH ₃) ₂	H	O	H
A-152	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃
A-153	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₃
A-154	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-155	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-156	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-157	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-158	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-159	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(CH ₃) ₃
A-160	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₃
A-161	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-162	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-163	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-164	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-165	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-166	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-167	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-168	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-169	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-170	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-171	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-piridilo)
A-172	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-173	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-174	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-175	CH(CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-176	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	H
A-177	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₃
A-178	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₃
A-179	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-180	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH(CH ₃) ₂
A-181	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-182	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-183	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-184	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-185	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₃
A-186	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-187	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-188	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-189	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-190	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-191	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-192	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)C ₆ H ₅
A-193	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-194	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-195	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-196	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-piridilo)
A-197	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-198	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-199	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-200	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-201	C(CH ₃) ₃	H	O	H
A-202	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₃
A-203	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₃
A-204	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-205	C(CH ₃) ₃	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-206	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-207	C(CH ₃) ₃	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-208	C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-209	C(CH ₃) ₃	H	O	C(CH ₃) ₃
A-210	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₃
A-211	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-212	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-213	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-214	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-215	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-216	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-217	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-218	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-219	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-220	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-221	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-piridilo)

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-222	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-223	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-224	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-225	C(CH ₃) ₃	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-226	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	H
A-227	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₃
A-228	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₃
A-229	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-230	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-231	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-232	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-233	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-234	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(CH ₃) ₃
A-235	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₃
A-236	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-237	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-238	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-239	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-240	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-241	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-242	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-243	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-244	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-245	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-246	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-piridilo)
A-247	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-248	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-249	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-250	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-251	c-C ₃ H ₅	H	O	H
A-252	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₃
A-253	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₃
A-254	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-255	c-C ₃ H ₅	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-256	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-257	c-C ₃ H ₅	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-258	c-C ₃ H ₅	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-259	c-C ₃ H ₅	H	O	C(CH ₃) ₃
A-260	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₃
A-261	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-262	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-263	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-264	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-265	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-266	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-267	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-268	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-269	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-270	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-271	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-piridilo)
A-272	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-273	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-274	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-275	c-C ₃ H ₅	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-276	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	H
A-277	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₃
A-278	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-279	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-280	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-281	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-282	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-283	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-284	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-285	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-286	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-287	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-288	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-289	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-290	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-291	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-292	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-293	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-294	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-295	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-296	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-piridilo)
A-297	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-298	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-299	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-300	c-C ₃ H ₅	CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-301	c-C ₅ H ₉	H	O	H
A-302	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₃
A-303	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₃
A-304	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-305	c-C ₅ H ₉	H	O	CH(CH ₃) ₂
A-306	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-307	c-C ₅ H ₉	H	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-308	c-C ₅ H ₉	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-309	c-C ₅ H ₉	H	O	C(CH ₃) ₃
A-310	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₃
A-311	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-312	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-313	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-314	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-315	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-316	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-317	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)C ₆ H ₅
A-318	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-319	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-320	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-321	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-piridilo)
A-322	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-323	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-324	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-325	c-C ₅ H ₉	H	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-326	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	H
A-327	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₃
A-328	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₃
A-329	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-330	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH(CH ₃) ₂
A-331	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-332	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-333	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-334	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(CH ₃) ₃
A-335	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₃
A-336	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-337	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-338	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-339	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-340	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-341	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-342	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)C ₆ H ₅
A-343	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-344	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-345	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-346	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-piridilo)
A-347	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-348	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-349	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-350	c-C ₅ H ₉	CH ₃	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-351	-CH ₂ CH ₂ -		O	H
A-352	CH ₂ CH ₂		O	CH ₃
A-353	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₃
A-354	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-355	CH ₂ CH ₂		O	CH(CH ₃) ₂
A-356	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-357	CH ₂ CH ₂		O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-358	CH ₂ CH ₂		O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-359	CH ₂ CH ₂		O	C(CH ₃) ₃
A-360	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₃
A-361	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-362	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-363	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-364	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-365	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-366	CH ₂ CH ₂		O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-367	CH ₂ CH ₂		O	C(O)C ₆ H ₅
A-368	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-369	CH ₂ CH ₂		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-370		CH ₂ CH ₂	O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-371		CH ₂ CH ₂	O	C(O)(4-piridilo)
A-372		CH ₂ CH ₂	O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-373		CH ₂ CH ₂	O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-374		CH ₂ CH ₂	O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-375		CH ₂ CH ₂	O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-376	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	H
A-377	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₃
A-378	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₃
A-379	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-380	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH(CH ₃) ₂
A-381	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-382	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-383	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-384	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(CH ₃) ₃
A-385	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₃
A-386	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₃
A-387	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-388	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-389	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-390	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH(CH ₂ F) ₂
A-391	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
A-392	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)C ₆ H ₅
A-393	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)
A-394	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-395	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-Cl-C ₆ H ₄)
A-396	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-piridilo)
A-397	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(2-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-398	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-399	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-400	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	C(O)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)
A-401	CH ₃	H	S	H
A-402	CH ₃	H	S	CH ₃
A-403	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-404	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-405	CH ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-406	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-407	CH ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-408	CH ₃	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-409	CH ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-410	CH ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-411	CH ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-412	CH ₃	CH ₃	S	H
A-413	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃
A-414	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-415	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-416	CH ₃	CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-417	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-418	CH ₃	CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-419	CH ₃	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ (CH ₃) ₂
A-420	CH ₃	CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-421	CH ₃	CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-422	CH ₃	CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-423	CH ₂ CH ₃	H	S	H
A-424	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₃
A-425	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-426	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-427	CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-428	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-429	CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-430	CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-431	CH ₂ CH ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-432	CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-433	CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-434	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	H
A-435	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₃
A-436	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-437	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-438	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-439	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-440	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-441	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-442	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-443	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-444	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-445	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	H
A-446	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₃
A-447	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-448	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-449	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-450	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-451	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-452	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-453	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-454	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-455	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-456	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	H
A-457	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₃
A-458	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-459	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-460	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-461	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-462	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-463	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-464	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-465	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-466	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-467	CH(CH ₃) ₂	H	S	H
A-468	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₃
A-469	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₃
A-470	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-471	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-472	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-473	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-474	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-475	CH(CH ₃) ₂	H	S	C(CH ₃) ₃
A-476	CH(CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₃
A-477	CH(CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-478	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	H
A-479	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₃
A-480	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-481	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-482	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH(CH ₃) ₂
A-483	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-484	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-485	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-486	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₃
A-487	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	C(S)CH ₃
A-488	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-489	C(CH ₃) ₃	H	S	H
A-490	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₃
A-491	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₃
A-492	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-493	C(CH ₃) ₃	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-494	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-495	C(CH ₃) ₃	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-496	C(CH ₃) ₃	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-497	C(CH ₃) ₃	H	S	C(CH ₃) ₃
A-498	C(CH ₃) ₃	H	S	C(S)CH ₃
A-499	C(CH ₃) ₃	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-500	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	H
A-501	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₃
A-502	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₃
A-503	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-504	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-505	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-506	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-507	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-508	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	C(CH ₃) ₃
A-509	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₃
A-510	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-511	c-C ₃ H ₅	H	S	H
A-512	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₃
A-513	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₃
A-514	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-515	c-C ₃ H ₅	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-516	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-517	c-C ₃ H ₅	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-518	c-C ₃ H ₅	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-519	c-C ₃ H ₅	H	S	C(CH ₃) ₃
A-520	c-C ₃ H ₅	H	S	C(S)CH ₃
A-521	c-C ₃ H ₅	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-522	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	H
A-523	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₃
A-524	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-525	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-526	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-527	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-528	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-529	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-530	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-531	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-532	c-C ₃ H ₅	CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-533	c-C ₅ H ₉	H	S	H
A-534	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₃
A-535	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₃
A-536	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-537	c-C ₅ H ₉	H	S	CH(CH ₃) ₂
A-538	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-539	c-C ₅ H ₉	H	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-540	c-C ₅ H ₉	H	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-541	c-C ₅ H ₉	H	S	C(CH ₃) ₃
A-542	c-C ₅ H ₉	H	S	C(S)CH ₃
A-543	c-C ₅ H ₉	H	S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-544	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	H
A-545	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₃
A-546	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₃
A-547	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-548	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH(CH ₃) ₂
A-549	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-550	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-551	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-552	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	C(CH ₃) ₃
A-553	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	C(S)CH ₃
A-554	c-C ₅ H ₉	CH ₃	S	C(S)CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
A-555	-CH ₂ CH ₂ -		S	H
A-556	CH ₂ CH ₂		S	CH ₃
A-557	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₃
A-558	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-559	CH ₂ CH ₂		S	CH(CH ₃) ₂
A-560	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-561	CH ₂ CH ₂		S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-562	CH ₂ CH ₂		S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-563	CH ₂ CH ₂		S	C(CH ₃) ₃
A-564	CH ₂ CH ₂		S	C(S)CH ₃
A-565	CH ₂ CH ₂		S	C(S)CH ₂ CH ₃
A-566	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	H
A-567	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₃
A-568	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₃
A-569	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-570	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH(CH ₃) ₂
A-571	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-572	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-573	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-574	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	C(CH ₃) ₃
A-575	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	C(S)CH ₃
A-576	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	C(S)CH ₂ CH ₃

Tabla B

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-1	CH ₃	H	O	OCH ₃
B-2	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-3	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-4	CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-5	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-6	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-7	CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-8	CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-9	CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-10	CH ₃	H	O	NH ₂
B-11	CH ₃	H	O	NHCH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-12	CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-13	CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-14	CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-15	CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-16	CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-17	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-18	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-19	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-20	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-21	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-22	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-23	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-24	CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-25	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-26	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-27	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-28	CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-29	CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-30	CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-31	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₃
B-32	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₃
B-33	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-34	CH ₃	CH ₃	O	OCH(CH ₃) ₂
B-35	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-36	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-37	CH ₃	CH ₃	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-38	CH ₃	CH ₃	O	OC(CH ₃) ₃
B-39	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-40	CH ₃	CH ₃	O	NH ₂
B-41	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₃
B-42	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₂ CH ₃
B-43	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-44	CH ₃	CH ₃	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-45	CH ₃	CH ₃	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-46	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃) ₂
B-47	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-48	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-49	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-50	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-51	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-52	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-53	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-54	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-55	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-56	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-57	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-58	CH ₃	CH ₃	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-59	CH ₃	CH ₃	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-60	CH ₃	CH ₃	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-61	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-62	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-63	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-64	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-65	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-66	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-67	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-68	CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-69	CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-70	CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-71	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-72	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-73	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-74	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-75	CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-76	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-77	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-78	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-79	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-80	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-81	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-82	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-83	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-84	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-85	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-86	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-87	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-88	CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-89	CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-90	CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-91	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-92	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-93	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-94	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-95	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-96	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-97	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-98	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-99	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-100	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-101	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-102	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-103	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-104	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-105	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-106	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-107	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-108	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-109	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-110	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-111	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-112	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-113	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-114	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-115	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-116	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-118	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-119	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-120	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-121	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃
B-122	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-123	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-124	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-125	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-126	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-127	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-128	CH(CH ₃) ₂	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-129	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-130	CH(CH ₃) ₂	H	O	NH ₂
B-131	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₃
B-132	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-133	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-134	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-135	CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-136	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃) ₂
B-137	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-138	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-139	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-140	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-141	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-142	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-143	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-144	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-145	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-146	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-147	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-148	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-149	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-150	CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-151	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-152	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-153	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-154	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-155	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-156	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-157	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-158	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-159	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-160	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-161	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-162	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-163	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-164	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-165	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-166	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-167	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-168	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-169	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-170	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-171	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-172	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-173	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-174	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-175	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-176	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-177	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-178	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-179	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-180	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-181	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₃
B-182	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-183	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-184	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-185	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-186	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-187	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-188	C(CH ₃) ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-189	C(CH ₃) ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-190	C(CH ₃) ₃	H	O	NH ₂
B-191	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₃
B-192	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-193	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-194	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-195	C(CH ₃) ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-196	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃) ₂

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-197	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-198	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-199	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-200	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-201	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-202	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-203	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-204	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-205	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-206	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-207	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-208	C(CH ₃) ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-209	C(CH ₃) ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-210	C(CH ₃) ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-211	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃
B-212	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-213	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-214	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-215	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-216	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-217	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-218	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-219	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-220	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NH ₂
B-221	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₃
B-222	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-223	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-224	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-225	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-226	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂
B-227	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-228	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-229	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-230	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-231	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-232	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-233	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂

No.	R ²	R ³	Y	Z
B-234	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-235	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-236	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-237	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-238	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-239	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-240	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)
B-241	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃
B-242	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₃
B-243	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-244	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃) ₂
B-245	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-246	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-247	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-248	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OC(CH ₃) ₃
B-249	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-250	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NH ₂
B-251	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₃
B-252	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₃
B-253	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₃
B-254	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH(CH ₃) ₂
B-255	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-256	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃) ₂
B-257	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-258	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-259	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-260	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-261	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃) ₂
B-262	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-263	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-264	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-265	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-266	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-267	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-268	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂
B-269	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
B-270	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	N(-CH ₂ CH ₂ N[CH ₃]CH ₂ CH ₂ -)

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

Además, la invención se refiere al uso farmacéutico de los compuestos según la in-
vención de la fórmula I y/o de las sales farmacéuticamente aceptables, especialmente
a su uso para el tratamiento de tumores en mamíferos, como por ejemplo, el hombre.

10

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

15

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades de plantas:

- especies de *Alternaria* en legumbres, colza, remolachas azucareras, frutas y arroz,
- especies de *Aphanomyces* en remolachas azucareras y legumbres,
- especies de *Bipolaris* y *Drechslera* en maíz, cereales, arroz y césped,
- 20 • *Blumeria graminis* (oidio) en cereales,
- *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, flores y viña,
- *Bremia lactucae* en lechuga,
- especies de *Cercospora* en maíz, soya, arroz y remolachas azucareras,
- especies de *Cochliobolus* en maíz, cereales, arroz, (p.ej. *Cochliobolus sativus* en
25 cereales, *Cochliobolus miyabeanus* en arroz),

- especies de *Colletotricum* en soja y algodón
 - especies de *Drechslera* en cereales y maíz,
 - especies de *Exserohilum* en maíz,
 - *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en cucurbitáceas,
- 5
- especies de *Fusarium* y *Verticillium* en diferentes plantas,
 - *Gaeumanomyces graminis* en cereales,
 - especies de *Gibberella*- en cereales y arroz (p.ej. *Gibberella fujikuroi* en arroz),
 - *Grainstaining complex* en arroz,
 - especies de *Helminthosporium* en maíz y arroz,
- 10
- *Microdochium nivale* en cereales,
 - especies de *Mycosphaerella* en cereales, pátanos y maní,
 - *Phakopsara pachyrhizi* y *Phakopsara meibomia* en soja,
 - especies de *Phomopsis* en soja y girasoles,
 - *Phytophthora infestans* en papas y tomates,
- 15
- *Plasmopara viticola* en viña,
 - *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
 - *Pseudocercospora herpotrichoides* en cereales,
 - especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y cucurbitáceas,
 - especies de *Puccinia* en cereales y maíz,
- 20
- especies de *Pyrenophora* en cereales,
 - *Pyricularia oryzae* , *Corticium sasakii* , *Sarocladium oryzae*, *S.attenuatum*, *Entylo-*
ma oryzae en arroz,
 - *Pyricularia grisea* en césped y cereales
 - *Pythium spp.* en césped, arroz, maíz, algodón, colza, girasoles, remolachas azuca-
- 25
- reras, legumbres y otras plantas,

- especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz, papas, césped, maíz, colza, papas, remolachas azucareras, legumbres y otras plantas,
- especies de *Sclerotinia* en colza y girasoles,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- 5 • *Erysiphe* (syn. *Uncinula*) *necator* en viña,
- especies de *Setosphaeria* en maíz y césped,
- *Sphacelotheca reilinia* en maíz,
- especies de *Thievaliopsis* en soja y algodón,
- especies de *Tilletia* en cereales,
- 10 • especies de *Ustilago* en cereales, maíz y remolachas azucareras y
- especies de *Venturia* (roña) en manzanas y peras.

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

15

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

20

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

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

En el tratamiento de las semillas, por ejemplo, espolvoreo, recubrimiento o regado de
5 las semillas, se suelen aplicar cantidades en ingrediente activo de 1 a 1000 g/100 kg de semillas, preferentemente, 1 a 200 g/100 kg, especialmente, 5 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.

10 Las 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.

Los compuestos de la fórmula I pueden estar presentes en diferentes modificaciones
15 cristalinas, que también son objeto de la presente invención .

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 asegura-
20 da una dispersión fina y uniforme del compuesto según la invención.

Las formulaciones para el tratamiento de semillas pueden contener adicionalmente aglutinantes y/o gelificantes y, opcionalmente, colorantes .

- Los aglutinantes se agregan para aumentar la adhesión de los ingredientes activos sobre las semillas después del. Aglutinantes apropiados son, por ejemplo, tensoactivos de copolimerizados de bloques de óxido de etileno/óxido de propileno, pero también alcoholes polivinílicos polivinilpirrolidonas, poliacrilatos polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestirenos, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, acetatos de polivinilo, tilosa y copolímeros de estos polímeros. Un agente gelificante apropiado es, por ejemplo carragaen (Satiagel®).
- 10 Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, diluyendo el principio activo con disolventes y/o soportes, en caso de desearlo, usando emulsionantes y dispersantes. Como disolventes/sustancias auxiliares son apropiados, substancialmente, para este fin:
- agua, disolventes aromáticos (p.ej. productos Solvesso, xileno), parafinas (p.ej. fracciones de petróleo), alcoholes (p.ej. metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grasos y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,
- 15
- 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,

5 condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino

10 etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfíticas y metilcelulosa.

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

15 punto de ebullición mediano hasta elevado, como p.ej. keroseno o aceite diesel, además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina, tetrahidro-naftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol,

20 ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

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

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

- 10 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).

Para el tratamiento de semillas, las correspondientes formulaciones dos hasta diez veces diluidas dan concentraciones en ingrediente activo de 0,01 a 60% en peso, preferentemente, 0,1 a 40% en peso, en las formulaciones listas para el uso.

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

- 20 A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

10 partes en peso de un compuesto según la invención son disueltos con 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se agregan humectantes u otros auxiliares. En la dilución con agua se disuelve el ingrediente activo. De este modo se obtiene una formulación que contiene 10 % en peso de ingrediente activo.

25 vo.

B) Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en 70 partes en peso de ciclohexanona, adicionando 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión. El contenido en ingrediente activo asciende a 20 % en peso

C Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en 75 partes en peso de xileno adicionando dodecilbencenosulfonato de Ca y etoxilato de aceite de ricino (cada vez 5 partes en peso). Cuando se diluye con agua se obtiene una emulsión. La formulación contiene 15 % en peso de ingrediente activo.

D Emulsiones (EW, EO, ES)

25 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en 35 partes en peso de xileno adicionando dodecilbencenosulfonato de y etoxilato de aceite de ricino (5 partes en peso, respectivamente). Esta mezcla se introduce mediante una máquina emulsionadora (p.ej. Ultraturax) en 30 partes en peso de agua y se transforman en una emulsión estable. Cuando se diluye con agua se obtiene una emulsión. la formulación contiene 25 % en peso de ingrediente activo.

20

E Suspensiones (SC, OD, FS)

20 partes en peso de un compuesto según la invención se sesmenzan tras adición de 10 partes en peso de dispersante y humectante y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico en un molino de agitador de bola, obteniéndose una suspensión de ingrediente activo. Cuando se diluye con agua se obtiene una suspensión estable del

25

ingrediente activo. El contenido en ingrediente activo en la formulación asciende a 20 % en peso .

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

- 5 50 partes en peso de un compuesto según la invención se muen finamente tras adición de 50 partes en peso de dispersante y humectante y se transforman, valiéndose de aparatos técnicos (extrusora, torre de pulverización, lecho fluidizado), en granulados dispersables o solubles en agua. Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión estable o una solución estable del ingrediente activo. La formulación
- 10 contiene 50 % en peso de ingrediente activo.

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

- 75 partes en peso de un compuesto según la invención se muelen tras adición de 25 partes en peso de dispersante y humectante y gel de ácido silícico en un molino de rotor-estator. Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión estable o una solución estable del ingrediente activo. El contenido en ingrediente activo de la formulación
- 15 asciende a 75 % en peso.

H Formulaciones de gel

- 20 En un molino de bolas se muelen 20 partes en peso de un compuesto según la invención, 10 partes en peso de dispersante, parte en peso de gelificante y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico en una suspensión fina. Cuando se diluye con agua se obtiene una suspensión estable con 20 % en peso de ingrediente activo.

2. Productos para la aplicación directa

I Polvos (DP, DS)

5 partes en peso de un compuesto según la invención se muelen finamente y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente particulado. Se obtiene un agente de espolvoreo con 5 % en peso de ingrediente activo.

J Granulados (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de un compuesto según la invención se muelen finamente y se reúnen con 99,5 partes en peso de sustancia soporte. Procedimientos habituales para este fin son extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado. Se obtiene un granulado para la aplicación directa con 0,5 % en peso de ingrediente activo.

K Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

10 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo, xileno. De este modo se obtiene un producto para la aplicación directa con 10 % en peso de ingrediente activo.

Generalmente, se usan para el tratamiento de semillas concentrados solubles en agua (LS), suspensiones (FS), polvos (DS), polvos dispersables en agua y polveos solubles en agua (WS, SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y formulaciones de gel (GF). Estas formulaciones se pueden aplicar sobre las semillas en forma no diluida o, preferentemente, en forma diluida. La aplicación se puede efectuar antes de la siembra.

Preferentemente, se usan formulaciones FS para el tratamiento de semillas. Generalmente, estas formulaciones contienen 1 a 800 g/l de ingrediente activo, 1 a 200 g/l de tensoactivo, 0 a 200 g/l de anticongelante, 0 a 400 g/l de aglutinante, 0 a 200 g/l de colorantes y disolvente, preferentemente, agua.

5

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.

- 10 Las formas de aplicación dependen enteramente del fin de aplicación, pero en todo caso hay que asegurar una distribución lo más fina posible del los ingredientes activos según la invención.

- Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables, dispersiones de aceite) 15 adicionando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite se pueden homogeneizar las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente en agua con la ayuda de un humectante, agente adherente, dispersante o emulsionante. Alternativamente, se pueden preparar concentrados compuestos de la sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante, en caso dado, disolvente o 20 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 entre 0,0001 y 10%, preferentemente, de 25 entre 0,01 y 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.

- 5 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.

10

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

15 fungicidas, entonces se alcanza, frecuentemente, ampliar el espectro de acción se puede evitar el desarrollo de resistencias. En numerosos casos se alcanzan efectos sinérgicos

- La siguiente lista de fungicidas con los que se pueden mezclar los compuestos según
- 20 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, fenpro-
- 25 pidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf,

- anilino pirimidinas, tales como pirimetanilo, mepanipirima o ciprodinilo,
- antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomicina,
- azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, tritico-
5 nazol,
- dicarboximidas, tales como iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,
- 10 • ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamato, tiram, ziram, zineb,
- compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, benomilo, boscalida, carbendazima, carboxina, oxicarboxima, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mepronilo,
15 nuarimol, pentiopirad, probenazol, pirifenox, proquinazida, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina, (4'-bromo-bifenil-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-carboxílico, (4'-trifluorometil-bifenil-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-carboxílico, (4'-cloro-3'-fluoro-bifenil-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-
20 carboxílico, (3',4'-dicloro-4-fluoro-bifenil-2-il)-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-pirazol-4-carboxílico, (2-ciano-fenil)-amida de ácido 3,4-dicloro-isotiazol-5-carboxílico, 5-cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-cromen-4-ona, dimetilamida de ácido 3-(3-bromo-6-fluoro-2-metil-indol-1-sulfonil)-[1,2,4]triazol-1-sulfónico,

- fungicidas de cobre, tales como caldo de Burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,
- derivados de nitrofenilo, tales como binapacril, dinocap, dinobutona, nitroftal-isopropilo,
- 5 • fenilpirroles, tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,
- azufre,
- otros fungicidas, tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, diclomezina, diclocimet, dietofen-carb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentina-acetato, fenoxanilo, ferimzona,
- 10 fluazinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, ácido fosforoso y sus sales, iprovalicarb, hexaclorobenceno, mandipropamida, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenil)-etil)-2-metansulfonilamino-3-metil-butiramida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenil)-etil)-2-etanosulfonilamino-3-metil-
- 15 butiramida, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, 3-(4-cloro-fenil)-3-(2-isopropoxycarbonilamino-3-metil-butirilamino)-propionato de metilo, N-(1-(1-(4-cianofenil)etan-sulfonil)-but-2-il) carbamato de 4-fluorofenilo,
- estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina o trifloxistrobina,
- 20 • derivados de ácido sulfénico, tales como captan, diclofluanida, folpet, tolil-fluanida,
- amidas de ácido cinámico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

Ejemplos de síntesis

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

Ejemplo 1 – Preparación de 2-[5-cloro-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamino]-butan-1-ol

10

Una solución de 500 mg (1,57 mmoles) de 5,7-dicloro-6-(2,4,6-trifluor-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina en 4 ml de diclorometano se mezcló con 1,57 mmoles de trietilamina y 1,57 mmoles de 2-amino-butan-1-ol, luego se agitó la mezcla a 20 hasta 25°C durante aprox. 15 horas. Entonces se extrajo la solución con 0,5m de HCl y solución al 5% de NaCl. Las fases orgánicas se secaron y se libraron del disolvente, Quedaron 535 mg del compuesto indicado en el título como cristales de color amarillo claro del p.f. 76-77°C.

15

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8,2 (1H, s); 6,85 (2H, q); 6,7 (1H, ancho, NH); 3,85 (1H, s, ancho); 3,7 (2H, q); 3,5(1H, s, ancho); 1,65 (1H, m); 1,55 (1H, m); 0,8 (3H, t).

20

Ejemplo 2 – Preparación de acetato de 2-[5-cloro-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-
[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamino]-butilo

Una solución de 50 mg (0,13 mmol) de 2-[5-cloro-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]tri-
5 azolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamino]-butan-1-ol (ver Ej. 1) en 2ml de diclorometano se mezc-
ló con 0,13 mmol, respectivamente, de trietilamina, anhídrido de ácido acético y 4-N,N-
dimetilaminopiridina. La solución se agitó a 20 hasta 25°C durante aprox. 5 horas.
Entonces se extrajo la solución con HCl 0,5m y solución al 5% de NaCl. Las fases or-
gánicas se secaron y se libraron del disolvente. Quedaron 36 mg del compuesto indi-
10 cado en el título como cristales de color amarillo claro del p.f. 39-42.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8,4 (1H, s); 6,9 (2H, t); 6,4 (1H, ancho, NH); 4,05 (2H, d);
3,7 (1H, ancho); 2,0 (3H, s); 1,55 (2H, m); 0,85 (3H, t).

Ejemplo 3 – Preparación de [5-cloro-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-
15 a]pirimidin-7-il]- (1-etoximetil-propil)-amina

Una solución de 20 mg (0,05 mmol) de 2-[5-cloro-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]tri-
azolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamino]-butan-1-ol (ver Ej. 1) en 1ml de acetona se mezcló con
0,05 mmol de carbonato de cesio y 0,05 mmol de yodoetano, luego se agitó la
20 suspensión por dos horas a 50°C. Después de haber agregado 5ml de diclorometano
se extrajo con 0,5m de HCl y solución al 5% de NaCl. Las fases orgánicas se secaron
y se libraron del disolvente. Quedaron 9 mg del compuesto indicado en el título como
aceite incoloro.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8,35 (1H, s); 6,85 (2H, m); 6,6 (1H, ancho, NH); 3,5 (1H,
25 ancho); 3,45 (2H, q); 3,4 (2H, d); 1,65 (1H, m); 1,5 (1H, m); 1,1 (3H, t); 0,75 (3H, t).

Los tiempos de retención de HPLC (temperatura ambiente) indicadas en las siguientes Tablas se determinaron usando la columna de RP-18 Chromolith Speed ROD (Cía. Merck KgaA, Alemania) con el eluyente + 0,1% de ácido trifluoroacético (TFA) / agua + 0,1% TFA en un gradiente de 5:95 a 95:5 en 5 min a 40°C. La espectrometría de masa

5 se realizó bajo ionización de electrospray cuadripolar, 80 V (modo positivo).

Compuestos de la fórmula I.1:

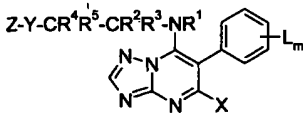


Tabla I

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-1	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3,35 min; [386 M+H] ⁺
I-2	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.60 min; [400 M+H] ⁺
I-3	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.38 min; [385 M+H] ⁺
I-4	H	CH ₃	H	H	H	O	C(CH ₃) ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.85 min; [413 M+H] ⁺
I-5	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.90 min; [413 M+H] ⁺
I-6	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.65 min; [399 M+H] ⁺
I-7	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [385 M+H] ⁺
I-8	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.56 min; [398 M+H] ⁺
I-9	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.54 min; [410 M+H] ⁺
I-10	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.95 min; [385 M+H] ⁺
I-11	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.79 min; [371 M+H] ⁺
I-12	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.06 min; [419 M+H] ⁺

88

189

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. {min}; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-13	H	CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.56 min; [357 M+H] ⁺
I-14	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	C [*] R ² R ³ en config. S 166-168°C
I-15	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.81 min; [371 M+H] ⁺
I-16	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.01 min; [385 M+H] ⁺
I-17	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.13 min; [413 M+H] ⁺
I-18	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [427 M+H] ⁺
I-19	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.55 min; [441 M+H] ⁺
I-20	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.29 min; [427 M+H] ⁺
I-21	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.50 min; [441 M+H] ⁺
I-22	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.69 min; [455 M+H] ⁺
I-23	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.15 min; [413 M+H] ⁺
I-24	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.38 min; [427 M+H] ⁺
I-25	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.60 min; [441 M+H] ⁺
I-26	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.37 min; [461 M+H] ⁺
I-27	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.57 min; [475 M+H] ⁺
I-28	H	C ₆ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.75 min; [489 M+H] ⁺
I-29	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	2.95 min; [399 M+H] ⁺

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-30	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.18 min; [413 M+H] ⁺
I-31	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.38 min; [427 M+H] ⁺
I-32	H	CH ₃	H	C ₆ H ₅	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.29 min; [433 M+H] ⁺
I-33	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	164-167°C
I-34	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.34 min; [427 M+H] ⁺
I-35	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.54 min; [441 M+H] ⁺
I-36	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [455 M+H] ⁺
I-37	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	72-74°C
I-38	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	78-81°C
I-39	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	70-73°C
I-40	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	3.03 min; [395 M+H] ⁺
I-41	H	CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	2.67 min; [367 M+H] ⁺
I-42	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-OCH ₃	2.83 min; [381 M+H] ⁺
I-43	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	2.99 min; [383 M+H] ⁺
I-44	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	3.00 min; [383 M+H] ⁺
I-45	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	2.78 min; [369 M+H] ⁺
I-46	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	H	Cl	2-Cl,6-F	67-69°C
I-47	H	CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	76-79°C

17

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos fisicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-48	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	80-82°C
I-49	H	CH ₃	H	H	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [416 M+H] ⁺
I-50	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	S	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.67 min; [416 M+H] ⁺
I-51	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.45 min; [427 M+H] ⁺
I-52	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.70 min; [441 M+H] ⁺
I-53	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.92 min; [455 M+H] ⁺
I-54	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [447 M+H] ⁺
I-55	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.65 min; [475 M+H] ⁺
I-56	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.48 min; [463 M+H] ⁺
I-57	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.88 min; [469 M+H] ⁺
I-58	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)C(=CH ₂)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.67 min; [453 M+H] ⁺
I-59	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.59 min; [441 M+H] ⁺
I-60	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)C(=CH ₂)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.35 min; [425 M+H] ⁺
I-61	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.74 min; [475 M+H] ⁺
I-62	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.48 min; [463 M+H] ⁺
I-63	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.06 min; [469 M+H] ⁺
I-64	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)C(=CH ₂)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.85 min; [453 M+H] ⁺
I-65	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.51 min; [441 M+H] ⁺

83

192

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. (min); MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-66	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [455 M+H] ⁺
I-67	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.90 min; [469 M+H] ⁺
I-68	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.83 min; [490 M+H] ⁺
I-69	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.66 min; [477 M+H] ⁺
I-70	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.06 min; [483 M+H] ⁺
I-71	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.99 min; [385 M+H] ⁺
I-72	H	CH ₃	CH ₃	H	H	S	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.77 min; [415 M+H] ⁺
I-73	H	CH ₃	CH ₃	H	H	S	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.57 min; [401 M+H] ⁺
I-74	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.39 min; [437 M+H] ⁺
I-75	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.60 min; [452 M+H] ⁺
I-76	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.80 min; [466 M+H] ⁺
I-77	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.36 min; [438 M+H] ⁺
I-78	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.57 min; [452 M+H] ⁺
I-79	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.77 min; [466 M+H] ⁺
I-80	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.24 min; [424 M+H] ⁺
I-81	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.46 min; [438 M+H] ⁺
I-82	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.65 min; [452 M+H] ⁺
I-83	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.48 min; [438 M+H] ⁺

82

4

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos fisicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-84	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.71 min; [452 M+H] ⁺
I-85	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.91 min; [466 M+H] ⁺
I-86	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.02 min; [410 M+H] ⁺
I-87	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.24 min; [424 M+H] ⁺
I-88	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.45 min; [438 M+H] ⁺
I-89	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.19 min; [424 M+H] ⁺
I-90	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.42 min; [438 M+H] ⁺
I-91	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.62 min; [452 M+H] ⁺
I-92	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.35 min; [426 M+H] ⁺
I-93	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.56 min; [440 M+H] ⁺
I-94	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.76 min; [454 M+H] ⁺
I-95	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.33 min; [426 M+H] ⁺
I-96	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.53 min; [440 M+H] ⁺
I-97	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.73 min; [454 M+H] ⁺
I-98	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.17 min; [412 M+H] ⁺
I-99	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.41 min; [426 M+H] ⁺
I-100	H	CH ₃	H	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.61 min; [440 M+H] ⁺
I-101	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.43 min; [426 M+H] ⁺

85

444

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-102	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.67 min; [440 M+H] ⁺
I-103	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.91 min; [454 M+H] ⁺
I-104	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	2.95 min; [398 M+H] ⁺
I-105	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.18 min; [412 M+H] ⁺
I-106	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.40 min; [426 M+H] ⁺
I-107	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.14 min; [412 M+H] ⁺
I-108	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.36 min; [426 M+H] ⁺
I-109	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.57 min; [440 M+H] ⁺
I-110	H	CH ₂ CH ₃	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.68 min; [421 M+H] ⁺
I-111	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.66 min; [409 M+H] ⁺
I-112	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	3.29 min; [397 M+H] ⁺
I-113	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.76 min; [465 M+H] ⁺
I-114	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.93 min; [479 M+H] ⁺
I-115	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2-Cl,6-F	3.71 min; [453 M+H] ⁺
I-116	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2-Cl,6-F	3.89 min; [467 M+H] ⁺
I-117	H	CH ₃	H	H	H	O	CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.37 min; [386 M+H] ⁺
I-118	H	CH ₃	H	H	H	O	C(O)C(CH ₃)=CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [425 M+H] ⁺
I-119	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.74 min; [476 M+H] ⁺

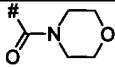
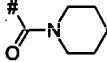
86

195

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-120	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.49 min; [463 M+H] ⁺
I-121	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.07 min; [469 M+H] ⁺
I-122	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C(O)C(CH ₃)=CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.85 min; [453 M+H] ⁺
I-123	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.52 min; [441 M+H] ⁺
I-124	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.73 min; [455 M+H] ⁺
I-125	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.91 min; [469 M+H] ⁺
I-126	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.84 min; [490 M+H] ⁺
I-127	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.67 min; [477 M+H] ⁺
I-128	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.06 min; [483 M+H] ⁺
I-129	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)C(CH ₃)=CH ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.87 min; [467 M+H] ⁺
I-130	CH ₃	CH ₃	H	H	3-metil-isoxazolidin-5-ilo			Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [426 M+H] ⁺
I-131	H	CH ₃	H	H	H	O	C ₂ H ₅	Cl	2,4,6-F ₃	3.36 min; [385 M+H] ⁺
I-132	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.50 min; [441 M+H] ⁺
I-133	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)C ₂ H ₅	Cl	2,4,6-F ₃	3.70 min; [455 M+H] ⁺
I-134	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.88 min; [469 M+H] ⁺
I-135	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CHClCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.81 min; [489 M+H] ⁺
I-136	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CHF ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.64 min; [477 M+H] ⁺
I-137	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.04 min; [483 M+H] ⁺

196

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-138	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	3.18 min; [399 M+H] ⁺
I-139	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	H	OCH ₃	2,4,6-F ₃	3.08 min; [395 M+H] ⁺
I-140	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	OCH ₃	2,4,6-F ₃	3.07 min; [395 M+H] ⁺
I-141	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,6-F	3.22 min; [398 M+H] ⁺
I-142	H	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	O	H	Cl	2-Cl,4-OCH ₃	3.25 min; [410 M+H] ⁺
I-143	H	C(CH ₃) ₃	H	=O		O	CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.56 min; [427 M+H] ⁺
I-144	H	CH ₃	CH ₃	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	1,4 (6H); 3,4 (2H); 5,1 (1H); 6,5 (1H); 6,9 (2H); 8,35 (1H)
I-145	H	CH ₃	CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	2,4,6-F ₃	149-153°C
I-146	H	CF ₃	H	=O		O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.85 min; [425 M+H] ⁺
I-147	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)OCH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.30 min; [457 M+H] ⁺
I-148	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)N(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.27 min; [470 M+H] ⁺
I-149	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	SO ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.22 min; [477 M+H] ⁺
I-150	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	205-208°C
I-151	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	O	H	CH ₃	2,4,6-F ₃	197-200°C
I-152	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)O(CH ₂) ₃ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.91 min; [499 M+H] ⁺
I-153	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)OCH ₂ CCl ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.94 min; [574 M+H] ⁺

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	Z	X	L _m	Datos fisicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]; ¹ H-NMR [δ ppm]
I-154	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)O(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.72 min; [485 M+H] ⁺
I-155	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O		Cl	2,4,6-F ₃	3.23 min; [512 M+H] ⁺
I-156	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)OCH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.54 min; [471 M+H] ⁺
I-157	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O		Cl	2,4,6-F ₃	3.70 min; [510 M+H] ⁺
I-158	H	C(CH ₃) ₃	H	H	H	O	C(O)N[CH(CH ₃)C ₂ H ₅] ₂	Cl	2,4,6-F ₃	4.26 min; [555 M+H] ⁺

caracteriza el enlace con Y

JP

Compuestos de la fórmula I.2

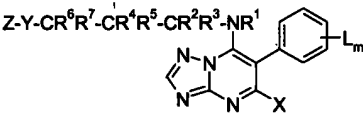


Tabla II

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y	Z	X	L _m	Datos físicos HPLC (T.amb. [min]; MS [m/z]); p.f. [°C]
II-1	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	H	Cl	2,4,6-F ₃	2.59 min; [371 M+H] ⁺
II-2	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	C(O)CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.04 min; [413 M+H] ⁺
II-3	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	C(O)CH ₂ CH ₃	Cl	2,4,6-F ₃	3.07 min; [427 M+H] ⁺
II-4	H	CH ₃	H	H	H	H	H	O	C(O)CH(CH ₃) ₂	Cl	2,4,6-F ₃	3.45 min; [441 M+H] ⁺

199

Ejemplos de la acción contra hongos nocivos

El efecto fungicida de los compuestos de la fórmula I pudo ser demostrada en la siguientes:

5

Los ingredientes activos se prepararon como solución madre obtenida con 25 mg de ingrediente activo, que se rellenó con una mezcla de acetona y/o DMSO. A esta solución se agregó 1% en peso de emulsionante Wettol EM 31 (humectante con efecto emulsionante y dispersante con base en alquilfenoles etoxilados). Estas soluciones madre se diluyeron con agua a la concentración en ingrediente activo abajo indicada.

10

Ejemplo de aplicación 1 – Eficiencia contra la alternariosis del tomate causada por *Alternaria solani*

15 Las hojas de plantas de tomate de la variedad "Goldene Königin" se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa con la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Al día siguiente se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani* en 2 % de solución de biomalta con una densidad $0,17 \times 10^8$ esporas/ml. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de

20 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 no tratadas pero infectadas, que la infección pudo ser determinada visualmente en por cien.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos Nos. I-1 a I-7, I-9, I-14, I-16, I-20, I-21, I-22, I-25, I-29, I-33 a I-40, I-43 a I-46, I-55, I-56, I-57, I-65, I-66, I-73

25

a I-80, I-83, I-84 y I-95 a I-97 presentaban una infección de, como máximo, un 15 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90 %.

5 Ejemplo de aplicación 2 – Eficiencia contra la helmintosporiosis de la cebada causada por *Pyrenophora teres* en la aplicación protectora de un día

Las hojas de plántulas de cebada de la variedad "Hanna" cultivadas en macetas se pulverizaron hasta chorrear con suspensiones acuosas de la concentración en ingrediente activo abajo indicada. 24 horas después de estar seca la capa pulverizada se inocularon
10 las plantas de ensayo con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora [syn. Drechslera] teres*, el patógeno de la helmintosporiosis. A continuación, se colocaron las plantas de ensayo en el invernadero a temperaturas de entre 20 y 24°C y 95 a 100 % de humedad relativa del aire. Después de seis días se evaluó la extensión del desarrollo de la enfermedad en por cien con respecto a la superficie total de hoja.

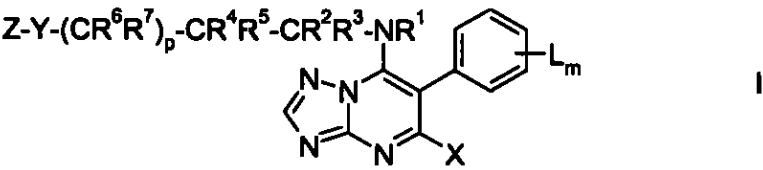
15

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos Nos. I-1, I-2, I-6 a I-11, I-14 a I-24, I-33 a I-40, I-44, I-45, I-55 a I-58, I-71, I-74, I-76 y I-77 presentaban una infección de, como máximo, un 10 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infectadas en hasta un 90%.

20

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



5 en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹ significa hidrógeno, C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₁₂-alquenilo, C₂-C₁₂-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-halógenocicloalquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, C₂-C₁₂-halógenoalquinilo o fenilo, 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 significa C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o fenilo, 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,

20 R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ significan hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R²,

R⁴ también puede formar con R³ o R⁶ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

5

R² con R³, R⁴ con R⁵, R⁶ con R⁷ también pueden significar juntos oxígeno para la formación de grupos carbonilo y formar una cadena de C₂-C₅-alquileo o alquilenilo, alquinileo para la formación de grupos espiro, que puede estar interrumpida por uno a tres heteroátomos del grupo O, N y S;

10

R¹ a R⁷ pueden llevar cada vez uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes:

R^a significa halógeno, 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-C₆-alqueno, C₂-C₆-halógenoalqueno, C₃-C₆-cicloalqueno, C₂-C₆-alquenilo, C₃-C₆-halógenoalquenilo, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆-halógenoalquino, C₃-C₆-alquinoxio, C₃-C₆-halógenoalquinoxio, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquinoxio, oxi-C₁-C₃-alquilenoxio, fenilo, 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,

15

20

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

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

15

y/o uno a tres de los radicales siguientes:

20

cicloalquilo, cicloalcoxi, heterociclilo, heterociciloxi, pudiendo los sistemas cíclicos contener 3 a 10 miembros de anillo; arilo, ariloxi, ariltio, aril- C_1-C_6 -alcoxi, aril- C_1-C_6 -alquilo, hetarilo, hetariloxi, hetariltio, pudiendo los radicales arilo contener, preferentemente, 6 a 10 miembros de anillo, y los radicales hetarilo contener 5 ó 6 miembros de anillo, pudiendo los sistemas cíclicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por grupos alquilo o haloalquilo;

25

- p es cero ó 1;
- 5 L significa halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, ciano, nitro, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino, C₁-C₄-alquilcarbonilamino, C(O)-R, S(O)_n-R;
- 10 R significa hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino; pudiendo los grupos R estar sustituidos por uno a tres grupos R^b;
- n es cero, 1 ó 2;
- 15 m es 1, 2, 3, 4 ó 5;
- X significa halógeno, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi o C₁-C₂-halógenoalcoxi,
- 20 Y es oxígeno o azufre;
- Z significa hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₈-alquil-carbonilo, C₁-C₈-alcoxycarbonilo, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alqueniloxicarbonilo, C₃-C₈-alquiniloxicarbonilo, C₃-C₈-cicloalquilcarbonilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo, C₃-C₈-
- 25

205
206

cicloalcoxycarbonilo, C₂-C₈-cicloalqueniloxycarbonilo, C₁-C₈-alquilsulfinilo, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₈ alquilsulfonilo, fenilo, 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; o

5

Z también puede formar con R⁵ o R⁷ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono e Y puede llevar uno o dos heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

10

el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b;

15

R^A, R^B significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₃-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalquenilo;

20

R^A y R^B pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde los sustituyentes tienen los significados siguientes:

25

206
207

5 R^1 significa hidrógeno, C_1 - C_{12} -alquilo, C_1 - C_{12} -halógenoalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquilo, C_2 - C_{12} -alquenilo, C_2 - C_{12} -halógenoalquenilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquenilo, C_2 - C_{12} -alquinilo, C_2 - C_{12} -halógenoalquinil o fenilo, 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,

10 R^2 significa C_1 - C_8 -alquilo, C_1 - C_8 -halógenoalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquilo, C_2 - C_8 -alquenilo, C_2 - C_8 -halógenoalquenilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquenilo, C_2 - C_8 -alquinilo, C_2 - C_8 -halógenoalquinilo o fenilo, 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 R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 significan hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R^2 ,

20 R^4 también puede formar con R^3 o R^6 un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a ;

R^2 con R^3 , R^4 con R^5 , R^6 con R^7 también pueden significar juntos oxígeno para la formación de grupos carbonilo y formar una cadena de C_2 - C_5 -alquileno o alquenileno, alquinileno para la formación de grupos espiro,

que puede estar interrumpida por uno a tres heteroátomos del grupo O, N y S;

5 R¹ a R⁷ pueden llevar cada vez uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes según la reivindicación 1;

10 Z significa hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₈-alquilcarbonilo, C₃-C₈-cicloalquilcarbonilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo, fenilo, naftilo, un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S; o

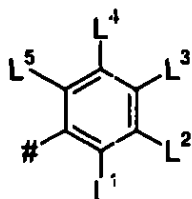
15 Z también puede formar con R⁴ o R⁶ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono e Y puede llevar uno o dos heteroátomos adicionales del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o uno o varios sustituyentes R^a;

20 el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b según la reivindicación 1.

3. Compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, donde X significa cloro o metilo, especialmente, cloro.

4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde el índice p es igual a cero.
5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4, donde por lo menos un grupo L se encuentra en la posición orto con respecto al lugar de enlace con el esqueleto de triazolopirimidina.

6. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, donde el grupo fenilo sustituido por L_m represente el grupo A



10

donde # representa el lugar de enlace con el esqueleto de triazolopirimidina y

L^1 significa flúor, cloro, CH_3 o CF_3 ;

L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno o flúor;

L^3 significa hidrógeno, flúor, cloro, CN, CH_3 , OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$, $N(CH_3)_2$,

15

$C(O)NH_2$ o $C(O)CH_3$; y

L^5 significa hidrógeno, flúor, cloro o CH_3 .

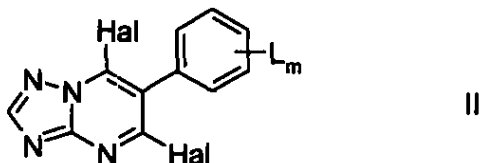
7. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 6, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa una de las siguientes combinaciones de sustitución: 2-fluoro-6-cloro, 2,6-difluoro, 2,6-dicloro, 2-fluoro-6-metilo, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-metoxi, 2-cloro-4-metoxi, pentafluoro, 2-metil-4-fluoro, 2-trifluorometilo, 2-metoxi-6-fluoro, 2-cloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-cloro, 2-cloro-4-fluoro, 2-cloro-5-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-metilo,

20

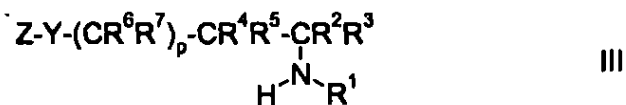
207
210

2,4-dimetilo, 2-metil-4-cloro, 2-metil-5-fluoro, 2-fluoro-4-metilo, 2,6-dimetilo, 2,4,6-trimetilo, 2,6-difluoro-4-metilo, 2-trifluorometil-4-fluoro, 2-trifluorometil-5-fluoro ó 2-trifluorometil-5-cloro.

- 5 8. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, donde X significa halógeno, haciendo reaccionar dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula II,



- 10 en la que las variables tienen las definiciones indicadas para la fórmula I y Hal representa un átomo de halógeno, especialmente, cloro, con aminas de la fórmula III.



- 15 9. Procedimiento según la reivindicación 8, donde Z significa hidrógeno.
10. Producto apropiados para combatir hongos nocivos, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2.
- 20 11. Producto según la reivindicación 10, que contiene además de un compuesto de la fórmula I adicionalmente otro ingrediente activo.
12. Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado por que se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a pro-

teger frente a la infección por los hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

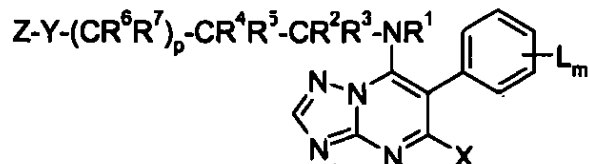
13. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I en una cantidad de 1 a
5 1000 g por 100 kg.

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

Resumen

5

La presente invención se refiere a 6-fenil-7-amino-triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

- 10 R^1 significa hidrógeno, C_1 - C_{12} -alquilo, C_1 - C_{12} -halógenoalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquilo, C_2 - C_{12} -alquenilo, C_2 - C_{12} -halógenoalquenilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquenilo, C_2 - C_{12} -alquinilo, C_2 - C_{12} -halógenoalquinilo o fenilo, 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 R^2 significa C_1 - C_8 -alquilo, C_1 - C_8 -halógenoalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquilo, C_2 - C_8 -alquenilo, C_2 - C_8 -halógenoalquenilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, C_3 - C_8 -halógenocicloalquenilo, C_2 - C_8 -alquinilo, C_2 - C_8 -halógenoalquinilo o fenilo, 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,
- 20

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 significan hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R^2 ,

5 R^4 también puede formar con R^3 o R^6 un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^8 ;

10 R^2 con R^3 , R^4 con R^5 , R^6 con R^7 también pueden significar juntos oxígeno para la formación de grupos carbonilo y formar una cadena de C_2-C_5 -alquileo o alqueni- leno, alquilileno para la formación de grupos espiro, que puede estar interrumpi- da por uno a tres heteroátomos del grupo O, N y S;

R^1 a R^7 pueden llevar cada vez uno a cuatro grupos R^8 iguales o diferentes:

15 R^8 significa halógeno, ciano, nitro, hidroxí, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 - halógenoalquilo, C_1-C_6 -alquilcarbonilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -halógenoalcoxi, C_1-C_6 -alcoxycarbonilo, C_1-C_6 -alquiltio, C_1-C_6 - alquilamino, di- C_1-C_6 -alquilamino, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 - halógenoalquenilo, C_3-C_6 -cicloalquenilo, C_2-C_6 -alqueniloxi, C_3-C_6 - halógenoalqueniloxi, C_2-C_6 -alquinilo, C_2-C_6 -halógenoalquinilo, C_3-C_6 - alquiniloxi, C_3-C_6 -halógenoalquiniloxi, C_3-C_6 -cicloalcoxi, C_3-C_6 -ciclo- alqueniloxi, oxi- C_1-C_3 -alquilenoxi, fenilo, naftilo, un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que con- tiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

25

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

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

y/o uno a tres de los radicales siguientes:

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

p es cero ó 1;

25

- L significa halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, ciano, nitró, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino, C₁-C₄-alquilcarbonilamino, C(O)-R, S(O)_n-R;
- 5 R significa hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino; pudiendo los grupos R estar sustituidos por uno a tres grupos R^b;
- n es cero, 1 ó 2;
- 10 m es 1, 2, 3, 4 ó 5;
- X significa halógeno, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi o C₁-C₂-halógenoalcoxi,
- 15 Y es oxígeno o azufre;
- Z significa hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₈-alquil-carbonilo, C₁-C₈-alcoxycarbonilo, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alqueniloxicarbonilo, C₃-C₈-alquiniloxicarbonilo, C₃-C₈-cicloalquilcarbonilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo, C₃-C₈-cicloalcoxycarbonilo, C₃-C₈-cicloalqueniloxicarbonilo, C₁-C₈-alquilsulfinilo, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₈-alquilsulfonilo, fenilo, 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; o

215
216

Z también puede formar con R⁵ o R⁷ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono e Y puede llevar uno o dos heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

5

el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b;

10

R^A, R^B significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalquenilo;

15

R^A y R^B pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

20

procedimientos para la preparación de estos compuestos, productos que los contienen, así como el uso de los mismos para combatir hongos nocivos fitopatógenos.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/009456

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES C07D487/04 A01N43/90 //(C07D487/04,249:00,239:00)		
Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Bez. Anspruch Nr.
X	WO 02/38565 A (BASF AG) 16. Mai 2002 (2002-05-16) * Tab. A: Nr. I-32Ansprüche 1-9	1-13
Y	EP 0 945 453 A (AMERICAN CYANAMID CO.) 29. September 1999 (1999-09-29) Ansprüche 1-12	1-13
Y	FR 2 784 381 A (AMERICAN CYANAMID CO.) 14. April 2000 (2000-04-14) Ansprüche 1-14	1-13
Y	US 6 117 865 A (K.-J. PEES) 12. September 2000 (2000-09-12) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-9	1-13
	----- -/-	
☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen		
☒ Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		
E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		
L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)		
O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht		
P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		
T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist		
X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden		
Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist		
A Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
23. Dezember 2005		02/01/2006
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentleaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Beauftragter Herz, C

217
218

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/009456

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INTERNATIONALE MAATSCHAPPIJ B.V.) 7. Juli 1993 (1993-07-07) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-10	1-13
Y	US 6 117 876 A (K.-J. PEES, G. ALBERT) 12. September 2000 (2000-09-12) Ansprüche 1-9	1-13
Y	WO 02/50077 A (BAYER AG) 27. Juni 2002 (2002-06-27) Ansprüche 1-9	1-13
Y	WO 98/46607 A (AMERICAN CYANAMID CO.) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-11	1-13
Y	US 6 297 251 B1 (K.-J. PEES, G. ALBERT) 2. Oktober 2001 (2001-10-02) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-11	1-13

218

219

INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abzeichen

PCT/EP2005/009456

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0238565 A	16-05-2002	AU 2183102 A EP 1368351 A2 JP 2004513170 T US 2004110771 A1	21-05-2002 10-12-2003 30-04-2004 10-06-2004
EP 0945453 A	29-09-1999	DK 945453 T3	16-12-2002
FR 2784381 A	14-04-2000	JP 2000103790 A	11-04-2000
US 6117865 A	12-09-2000	KEINE	
EP 0550113 A	07-07-1993	AT 159256 T AT 192154 T AU 667204 B2 AU 3043592 A BR 9205172 A CA 2086404 A1 CN 1075144 A CN 1141119 A DE 69222746 D1 DE 69222746 T2 DE 69230977 D1 DE 69230977 T2 DK 550113 T3 ES 2108727 T3 ES 2147411 T3 GR 3025920 T3 HK 1010105 A1 HU 63305 A2 IL 104244 A JP 3347170 B2 JP 5271234 A NZ 245581 A PL 297160 A1 PL 171579 B1 PT 782997 T RU 2089552 C1 SG 47563 A1 ZA 9210043 A	15-11-1997 15-05-2000 14-03-1996 01-07-1993 06-07-1993 01-07-1993 11-08-1993 29-01-1997 20-11-1997 12-02-1998 31-05-2000 09-11-2000 09-02-1998 01-01-1998 01-09-2000 30-04-1998 23-06-2000 30-08-1993 13-07-1997 20-11-2002 19-10-1993 26-07-1995 06-09-1993 30-05-1997 29-09-2000 10-09-1997 17-04-1998 28-07-1993
US 6117876 A	12-09-2000	KEINE	
WO 0250077 A	27-06-2002	AU 3167602 A DE 10063115 A1 EP 1349859 A2 JP 2004516296 T US 2004097522 A1	01-07-2002 27-06-2002 08-10-2003 03-06-2004 20-05-2004
WO 9846607 A	22-10-1998	AT 202779 T AU 6576898 A DE 69801048 D1 DE 69801048 T2 DK 975634 T3 EP 0975634 A1 ES 2160408 T3 GR 3036714 T3 PT 975634 T ZA 9803055 A	15-07-2001 11-11-1998 09-08-2001 14-03-2002 24-09-2001 02-02-2000 01-11-2001 31-12-2001 28-12-2001 11-10-1999

229
220

INTERNATIONALES RESEARCHENBERICHT
Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/009456

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 6297251	B1	02-10-2001	KEINE

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 0000055874/N1		WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/009456		Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 02.09.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 08.09.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04			
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.			
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 4 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☒ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 7 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 07.07.2006		Datum der Fertigstellung dieses Berichts 15.09.2006	
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 	

Feld Nr. 1 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

1-70

in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-14

eingegangen am 07.07.2006 mit Telefax

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

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

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

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht 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.

222
223

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 1-14
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche 1-14
	Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 1-14
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

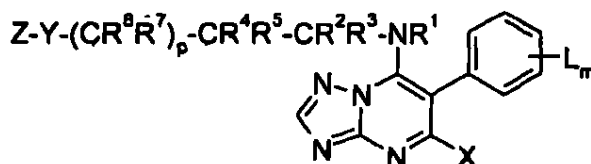
Nach Abgrenzung der Ansprüche vom nächstkommenden Stand der Technik, WO02/38565, durch Präzisierung der Bedeutung für den Substituenten Z 1 werden die beanspruchten Verbindungen gegenüber dem durch die im Recherchenbericht angeführten Dokumente ausgewiesenen Stand der Technik als neu erachtet [Art. 33 (2) PCT].

Im Hinblick auf die Ergebnisse der mit Eingabe vom 07/07/05 vorgelegten Vergleichsversuche, welche für die beanspruchten Verbindungen gegenüber diesem nächstkommenden Stand der Technik eine überraschende, signifikant erhöhte fungizide Aktivität glaubhaft machen, wird ihre Bereitstellung als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend angesehen [Art. 33 (3) PCT].

Patentansprüche

222
225

1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ Wasserstoff, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Halogencycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl, C₂-C₁₂-Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R² C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Halogencycloalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ Wasserstoff oder eine der bei R² genannten Gruppen,

R⁴ kann auch mit R³ oder R⁵ einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der neben Kohlenstoffatomen ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten R² tragen kann;

R² mit R³, R⁴ mit R⁵, R⁶ mit R⁷ können jeweils gemeinsam auch zur Bildung von Carbonylgruppen Sauerstoff bedeuten und zur Bildung von Spirogruppen eine C₂-C₅-Alkylen- oder Alkenylen, Alkinylenkette bilden, die durch ein bis drei Heteroatome aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein kann;

R¹ bis R⁷ können jeweils eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R⁸ tragen:

R⁸ Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogen-

- 5 alkoxy, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₁-C₈-Alkylamino, Di-C₁-C₈-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Halogenalkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl, C₃-C₈-Alkynyloxy, C₃-C₈-Halogenalkynyloxy, C₃-C₈-Cycloalkoxy, C₃-C₈-Cycloalkenyloxy, Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,
- 10 wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:
- 15 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- 20 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- 25 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₈-alkoxy, Aryl-C₁-C₈-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können;
- 30
- 35 p null oder 1;
- L Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Cyano, Nitro, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄)-Alkylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonylamino,
- 40 C(O)-R, S(O)_n-R;

226

- 5 R Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄)-Alkylamino; wobei die Gruppen R durch eine bis drei Gruppen R^b substituiert sein können;
- 10 n null, 1 oder 2;
- m 1, 2, 3, 4 oder 5;
- 15 X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy;
- 20 Y Sauerstoff oder Schwefel;
- Z Wasserstoff, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₁-C₈-Alkoxy-carbonyl, (C=O)NR^aR^b, C₃-C₈-Alkenyloxy-carbonyl, C₃-C₈-Alkinyloxy-carbonyl, C₃-C₈-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkoxy-carbonyl, C₃-C₈-Cycloalkenyloxy-carbonyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylthio, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; oder
- 25 Z kann auch mit R^a oder R⁷ einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der neben Kohlenstoffatomen und Y ein oder zwei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten R^a tragen kann;
- 30 die Gruppe Z kann partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen;
- 35 R^a, R^b unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₃-C₈-Cycloalkenyl;
- R^a und R^b können gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Ring bilden, der neben Kohlenstoffatomen ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N

und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten R^a tragen kann.

228

228

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R^1 Wasserstoff, C_1 - C_{12} -Alkyl, C_1 - C_{12} -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl, C_2 - C_{12} -Alkenyl, C_2 - C_{12} -Halogenalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkenyl, C_2 - C_{12} -Alkynyl, C_2 - C_{12} -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R^2 C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_2 - C_8 -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 Wasserstoff oder eine der bei R^2 genannten Gruppen,

R^4 kann auch mit R^3 oder R^5 einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der neben Kohlenstoffatomen ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten R^a tragen kann;

R^2 mit R^3 , R^4 mit R^5 , R^6 mit R^7 können jeweils gemeinsam auch zur Bildung von Spirogruppen eine C_2 - C_3 -Alkylen- oder Alkenylen, Alkinylenkette bilden, die durch ein bis drei Heteroatome aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein kann;

R^1 bis R^7 jeweils eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a gemäß Anspruch 1 tragen;

Z Wasserstoff, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_8 -Alkylcarbonyl, C_3 - C_8 -Cycloalkylcarbonyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_2 - C_8 -Halogenalkynyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Hetero-

cyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S;
oder

5

Z kann auch mit R^4 oder R^6 einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der neben Kohlenstoffatomen und Y ein oder zwei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten R^a tragen kann;

10

die Gruppe Z kann partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b gemäß Anspruch 1 tragen.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

15

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der der Index p null ist.

5. Verbindungen der Formel I gemäß der Ansprüche 1 bis 4, welche der Formel I.3 entsprechen

20



in der die Variablen die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen und Z folgende Bedeutung hat:

25

Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_8 -Alkoxy, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_3-C_8 -Alkenyloxy, C_3-C_8 -Alkinyloxy, C_3-C_8 -Cycloalkoxy, C_3-C_8 -Cycloalkenyloxy, $NR^A R^B$, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; die Gruppe Z kann partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen.

30

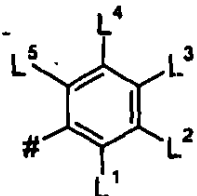
6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der mindestens eine Gruppe L orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidingerüst steht.

35

7. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A

229

230



A

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

L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ;

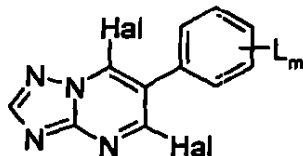
5 L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;

L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, CN, CH_3 , OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$, $N(CH_3)_2$, $C(O)NH_2$ oder $C(O)CH_3$; und

L^5 Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH_3 bedeuten.

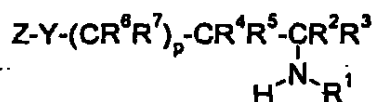
10 8. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für eine der folgenden Substituentenkombinationen steht: 2-Fluor-6-chlor, 2,6-Difluor, 2,6-Dichlor, 2-Fluor-6-methyl, 2,4,6-Tri-
15 fluor, 2,6-Difluor-4-methoxy, 2-Chlor-4-methoxy, Pentafluor, 2-Methyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl, 2-Methoxy-6-fluor, 2-Chlor, 2-Fluor, 2,4-Difluor, 2-Fluor-4-chlor, 2-Chlor-4-fluor, 2-Chlor-5-fluor, 2,3-Difluor, 2,5-Difluor, 2,3,4-Trifluor, 2-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Methyl-4-chlor, 2-Methyl-5-fluor, 2-Fluor-4-methyl, 2,6-Dimethyl, 2,4,6-Trimethyl, 2,6-Difluor-4-methyl, 2-Trifluormethyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl-5-fluor oder 2-Trifluormethyl-5-chlor.

20 9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X für Halogen steht, durch Umsetzung von Dihalogentriazolopyrimidinen der Formel II,



II

25 in der die Variablen die für Formel I gegebene Bedeutung haben und Hal für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor steht, mit Aminen der Formel III.



III

10. Verfahren gemäß Anspruch 9, in dem Z für Wasserstoff steht.

230

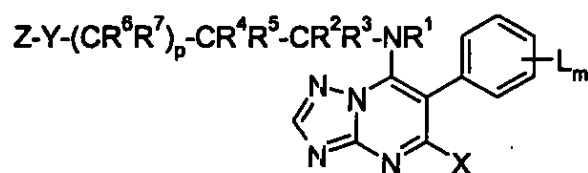
231

11. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2.
- 5 12. Mittel gemäß Anspruch 11, enthaltend neben einer Verbindung der Formel I zusätzlich einen weiteren Wirkstoff.
- 10 13. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.
14. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 in einer Menge von 1 bis 1000 g pro 100 kg.

231
232

Claims

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are as defined below:

10 R^1 is hydrogen, C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halo-cycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15 R^2 is C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

20 R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 are hydrogen or one of the groups mentioned under R^2 ,

25 R^4 , together with R^3 or R^6 , may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a ;

30 R^2 with R^3 , R^4 with R^5 , R^6 with R^7 may in each case together, with formation of carbonyl groups, also be oxygen and, with formation of spiro groups, form a C_2 - C_5 -alkylene, or alkenylene or alkynylene chain which may be interrupted by one to three heteroatoms from the group consisting of O, N and S;

35 R^1 to R^7 may in each case carry one to four identical or different groups R^a :

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl,

AMENDED SHEET

232

233

5

C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-alkynyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkoxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, oxy-C₁-C₃-alkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a 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,

10

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

15

R^b is halogen, 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 the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals comprise 2 to 8 carbon atoms;

20

25

and/or one to three of the following radicals:

30

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 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

35

p is zero or 1;

L is halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, cyano, nitro, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino, C₁-C₄-alkylcarbonylamino, C(O)-R, S(O)_n-R;

40

AMENDED SHEET

233

234

R is hydrogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy, C₂-C₄-alkynyloxy, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino; where the groups R may be substituted by one to three groups R^b;

5 n is zero, 1 or 2;

m is 1, 2, 3, 4 or 5;

10 X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy, C₂-C₄-alkynyloxy or C₁-C₂-haloalkoxy,

Y is oxygen or sulfur;

15 Z is hydrogen, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alkenyloxycarbonyl, C₃-C₈-alkynyloxycarbonyl, C₃-C₈-cycloalkylcarbonyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-cycloalkoxycarbonyl, C₃-C₈-cycloalkenyloxycarbonyl, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-alkylthio, C₁-C₈-alkylsulfonyl, phenyl, naphthyl, a five- to ten-

20 membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S; or

25 Z together with R⁵ or R⁷ may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms and Y, may comprise one or two further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a;

30 the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b;

R^A, R^B are independently hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl or C₃-C₈-cycloalkenyl;

35 R^A and R^B may combine with the nitrogen atom to which they are attached to form a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic ring which, as well as carbon atoms, may comprise from one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as a ring member and/or may carry one or

40 more substituents R^a.

AMENDED SHEET

224
235

2. The compound of the formula I according to claim 1 in which the substituents are as defined below:

- 5 R^1 is hydrogen, C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- 10 R^2 is C_1 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle
- 15 which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,
- R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 are hydrogen or one of the groups mentioned under R^2 ,
- 20 R^4 , together with R^3 or R^6 , may also form a five- or six-membered saturated or unsaturated ring which, in addition to carbon atoms, may comprise one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a ;
- 25 R^2 with R^3 , R^4 with R^5 , R^6 with R^7 may in each case together, with formation of spiro groups, form a C_2 - C_5 -alkylene, or alkenylene or alkynylene chain which may be interrupted by one to three heteroatoms from the group consisting of O, N and S;
- 30 R^1 to R^7 may in each case carry one to four identical or different groups R^a according to claim 1;
- 35 Z is hydrogen, C_1 - C_8 -haloalkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_3 - C_8 -cycloalkylcarbonyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -haloalkenyl, C_3 - C_8 -cycloalkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_2 - C_8 -haloalkynyl, phenyl, naphthyl, a 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; or

Z together with R^4 or R^6 may also form a five- or six-membered saturated or

AMENDED SHEET

235
236

unsaturated ring which, in addition to carbon atoms and Y, may comprise one or two further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents R^a;

5 the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b according to claim 1.

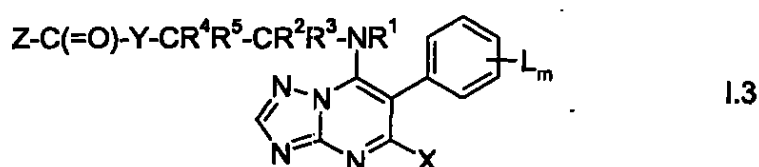
3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which X is chlorine or methyl, in particular chlorine.

10

4. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 3 in which the index p is zero.

5. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 4 which conform to the formula I.3

15



in which the variables are as defined according to the formula I and Z is defined as follows:

20

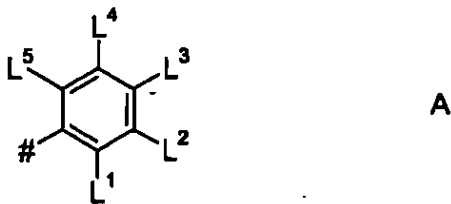
hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-alkenyloxy, C₃-C₈-alkynyloxy, C₃-C₈-cycloalkoxy, C₃-C₈-cycloalkenyloxy, NR^AR^B, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which comprises one to four heteroatoms from the group consisting of O, N or S; the group Z may be partially or fully halogenated or carry one to three groups R^b.

25

6. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 5 in which at least one group L is located in the ortho-position to the point of attachment to the triazolopyrimidine skeleton.

30

7. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 6 in which the phenyl group substituted by L_m is the group A



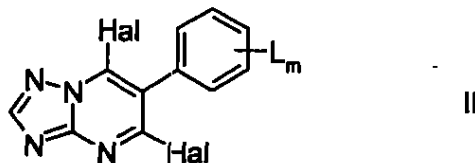
in which # is the point of attachment to the triazolopyrimidine skeleton and

AMENDED SHEET

237

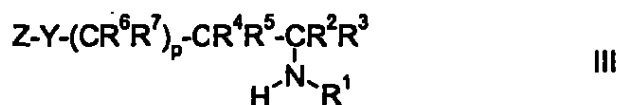
- L^1 is fluorine, chlorine, CH_3 or CF_3 ;
 L^2, L^4 independently of one another are hydrogen or fluorine;
 L^3 is hydrogen, fluorine, chlorine, CN, CH_3 , OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$, $N(CH_3)_2$,
 5 $C(O)NH_2$ or $C(O)CH_3$; and
 L^5 is hydrogen, fluorine, chlorine or CH_3 .

8. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 7 in which the
 phenyl group substituted by L_m is one of the combinations of substituents below:
 10 2-fluoro-6-chloro, 2,6-difluoro, 2,6-dichloro, 2-fluoro-6-methyl, 2,4,6-trifluoro,
 2,6-difluoro-4-methoxy, 2-chloro-4-methoxy, pentafluoro, 2-methyl-4-fluoro,
 2-trifluoromethyl, 2-methoxy-6-fluoro, 2-chloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro,
 2-fluoro-4-chloro, 2-chloro-4-fluoro, 2-chloro-5-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro,
 2,3,4-trifluoro, 2-methyl, 2,4-dimethyl, 2-methyl-4-chloro, 2-methyl-5-fluoro,
 15 2-fluoro-4-methyl, 2,6-dimethyl, 2,4,6-trimethyl, 2,6-difluoro-4-methyl,
 2-trifluoromethyl-4-fluoro, 2-trifluoromethyl-5-fluoro or 2-trifluoromethyl-5-chloro.
9. A process for preparing a compound of the formula I according to claim 1 or 2 in
 which X is halogen by reacting dihalotriazolopyrimidines of the formula II,



20

in which the variables are as defined for formula I and Hal is a halogen atom, in particular chlorine, with amines of the formula III.



- 25 10. The process according to claim 9 in which Z is hydrogen.
11. A composition suitable for controlling harmful fungi, which composition comprises a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to claim 1 or 2.
- 30 12. The composition according to claim 11 which, as well as a compound of the formula I, additionally comprises a further active compound.
13. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises

AMENDED SHEET

237

238

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.

- 5 14. Seed comprising a compound of the formula I in an amount from 1 to 1000 g per 100 kg.

AMENDED SHEET

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

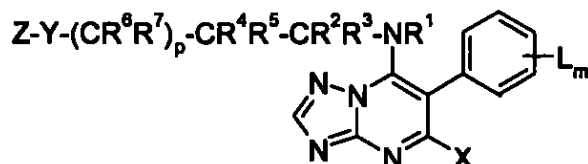
PARA REALIZAR EL EXAMEN DE

PATENTABILIDAD

239
240

Reivindicaciones

1. Triazolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los significados siguientes:

R¹ significa hidrógeno, C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₁₂-alquenilo, C₂-C₁₂-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-halógenocicloalquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, C₂-C₁₂-halógenoalquinilo o fenilo, 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 significa C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o fenilo, 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,

R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ significan hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R²,

R^4 también puede formar con R^3 o R^6 un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a ;

R^2 con R^3 , R^4 con R^5 , R^6 con R^7 también pueden significar juntos oxígeno para la formación de grupos carbonilo y formar una cadena de C_2 - C_5 -alquileo o alquenileo, alquinileo para la formación de grupos espiro, que puede estar interrumpida por uno a tres heteroátomos del grupo O, N y S;

R^1 a R^7 pueden llevar cada vez uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes:

R^a significa halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -halógenoalquilo, C_1 - C_6 -alquilcarbonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -halógenoalcoxi, C_1 - C_6 -alcoxycarbonilo, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -alquilamino, di- C_1 - C_6 -alquilamino, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -halógenoalquenilo, C_3 - C_6 -cicloalquenilo, C_2 - C_6 -alqueniloxi, C_3 - C_6 -halógenoalqueniloxi, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -halógenoalquinilo, C_3 - C_6 -alquiniloxi, C_3 - C_6 -halógenoalquiniloxi, C_3 - C_6 -cicloalcoxi, C_3 - C_6 -cicloalqueniloxi, oxi- C_1 - C_3 -alquilenoxi, fenilo, 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,

241
242

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

R^b significa halógeno, 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, pudiendo los grupos alquilo en estos radicales contener 1 a 6 átomos de carbono y pudiendo los mencionados grupos alquenilo o alquinilo en estos radicales contener 2 a 8 átomos de carbono;

y/o uno a tres de los radicales siguientes:

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

Página modificada

p es cero ó 1;

L significa halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, ciano, nitro, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino, C₁-C₄-alquilcarbonilamino, C(O)-R, S(O)_n-R;

R significa hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₂-halógenoalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino; pudiendo los grupos R estar sustituidos por uno a tres grupos R^b;

n es cero , 1 ó 2;

m es 1, 2, 3, 4 ó 5;

X significa halógeno, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₂-C₄-alqueniloxi, C₂-C₄-alquiniloxi o C₁-C₂-halógenoalcoxi,

Y es oxígeno o azufre;

Z significa hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₈-alquil-carbonilo, C₁-C₈-alcoxycarbonilo, (C=O)NR^AR^B, C₃-C₈-alqueniloxycarbonilo, C₃-C₈-alquiniloxycarbonilo, C₃-C₈-cicloalquilcarbonilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo, C₃-C₈-cicloalcoxycarbonilo, C₃-C₃-cicloalqueniloxycarbonilo, C₁-C₈-alquilsulfinilo,

Página modificada

C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₈ alquilsulfonilo, fenilo, 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; o

Z también puede formar con R⁵ o R⁷ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono e Y puede llevar uno o dos heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b;

R^A, R^B significan, independientemente, hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₂-C₈-alqueniilo, C₂-C₈-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalqueniilo;

R^A y R^B pueden formar junto con el átomo de nitrógeno, al que están ligados, un anillo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono pueden contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, donde los sustituyentes tienen los significados siguientes:

244
245

R¹ significa hidrógeno, C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₁₂-alquenilo, C₂-C₁₂-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-halógenocicloalquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, C₂-C₁₂-halógenoalquinil o fenilo, 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 significa C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halógenocicloalquilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₃-C₈-halógenocicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo o fenilo, 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,

R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ significan hidrógeno o uno de los grupos mencionados para R²,

R⁴ también puede formar con R³ o R⁶ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono puede contener uno a tres heteroátomos adicionales del grupo O, N y S como miembros de anillo y/o llevar uno o varios sustituyentes R^a;

R² con R³, R⁴ con R⁵, R³ con R⁷ también pueden significar juntos oxígeno para la formación de grupos carbonilo y formar una cadena de C₂-C₅-alquileno o alquenileno, alquinileno para la formación de grupos espiro,

que puede estar interrumpida por uno a tres heteroátomos del grupo O, N y S;

R¹ a R⁷ pueden llevar cada vez uno a cuatro grupos R^a iguales o diferentes según la reivindicación 1;

Z significa hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-halógenoalquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₈-alquilcarbonilo, C₃-C₈-cicloalquilcarbonilo, C₂-C₈-alquenilo, C₂-C₈-halógenoalquenilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C₂-C₈-alquinilo, C₂-C₈-halógenoalquinilo, fenilo, naftilo, un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático con cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo: O, N o S; o

Z también puede formar con R⁴ o R⁶ un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que además de átomos de carbono e Y puede llevar uno o dos heteroátomos adicionales del grupo: O, N y S como miembros anulares y/o uno o varios sustituyentes R^a;

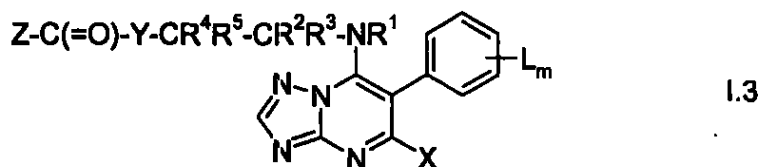
el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b según la reivindicación 1.

3. Compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, donde X significa cloro o metilo, especialmente, cloro.

246

247

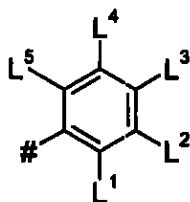
4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, donde el índice p es igual a cero.
5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4 que corresponden a la fórmula I.3



en la que las variables tienen los significados según la fórmula I y Z tiene los siguientes significados:

hidrógeno, C₁-C₈-alquilo, C₁-C₈-alcoxi, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-alquenilo, C₃-C₈-alquinoxio, C₃-C₈-alquinoxio, C₃-C₈-cicloalcoxi, C₃-C₈-cicloalquinoxio, NR^AR^B, heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco a diez miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S; el grupo Z puede estar parcial o completamente halogenado o llevar uno a tres grupos R^b.

6. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, donde por lo menos un grupo L se encuentra en la posición orto con respecto al lugar de enlace con el esqueleto de triazolo-pirimidina.
7. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 6, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa el grupo A



A

donde # representa el lugar de enlace con el esqueleto de trazolopirimidina y

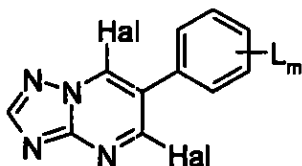
L^1 significa flúor, cloro, CH_3 o CF_3 ;

L^2, L^4 significan, independientemente, hidrógeno o flúor;

L^3 significa hidrógeno, flúor, cloro, CN , CH_3 , OCH_3 , NH_2 , NHCH_3 , $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ o $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$; y

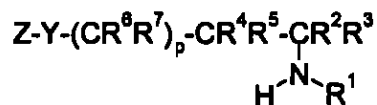
L^5 significa hidrógeno, flúor, cloro o CH_3 .

8. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 7, donde el grupo fenilo sustituido por L_m representa una de las siguientes combinaciones de sustitución: 2-fluoro-6-cloro, 2,6-difluoro, 2,6-dicloro, 2-fluoro-6-metilo, 2,4,6-trifluoro, 2,6-difluoro-4-metoxi, 2-cloro-4-metoxi, pentafluoro, 2-metil-4-fluoro, 2-trifluorometilo, 2-metoxi-6-fluoro, 2-cloro, 2-fluoro, 2,4-difluoro, 2-fluoro-4-cloro, 2-cloro-4-fluoro, 2-cloro-5-fluoro, 2,3-difluoro, 2,5-difluoro, 2,3,4-trifluoro, 2-metilo, 2,4-dimetilo, 2-metil-4-cloro, 2-metil-5-fluoro, 2-fluoro-4-metilo, 2,6-dimetilo, 2,4,6-trimetilo, 2,6-difluoro-4-metilo, 2-trifluorometil-4-fluoro, 2-trifluorometil-5-fluoro ó 2-trifluorometil-5-cloro.
9. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, donde X significa halógeno, haciendo reaccionar dihalógenotriazolopirimidinas de la fórmula II,



II

en la que las variables tienen las definiciones indicadas para la fórmula I y Hal representa un átomo de halógeno, especialmente, cloro, con aminas de la fórmula III.



III

10. Procedimiento según la reivindicación 9, donde Z significa hidrógeno.
11. Producto apropiados para combatir hongos nocivos, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2.
12. Producto según la reivindicación 11, que contiene además de un compuesto de la fórmula I adicionalmente otro ingrediente activo.
13. Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a la infección por los hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.
14. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.

Expediente No		070 34299	No de Folio
Item		No de unidades	✓
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS: X	1	✓

Observaciones:

on sobre q contiene
arte final.

2571

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

Rad: 07-034290- -00000-0000
Fec. 2007-04-04 16.44.35 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYII
Eve: 378 PRESENTACIONALII
Act 411 PRESENTACIONALII Folios 001

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 24,402
FECHA : MARZO 26 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CLENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55800346	26/03/2007	20,043,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN 482,000.00
		TOTAL :	\$ 482,000.00

SON: CUATROCIENTOS OCHENTA Y DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO 00361 841 159 3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad. 07-03-4293- -00000-0000

Fec. 2007-04-04 16:44:39 Dep. 2020 INUECREACIONES

Tra. 11 PATENTEYII

Eve. 379 FASENACIONALI

Acl 411 PRESENTACION

Folios. 251


ndustria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE PCT

PATENTE DE INVENCION

[X]

MODELO DE UTILIDAD []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Claudia M NevoC
 Firma Responsable

Fecha _____

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

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 253

2020
Bogotá D.C.,

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

REFERENCIA	Radicación No.	07 34299
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/009456
	Fecha inicio fase nacional	08/04/2007
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	3776
	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, 30 ABO. 2007

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

adpa11