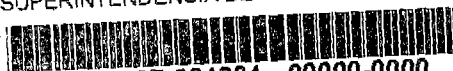


**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-094234- -00000-0000

Fecha: 2007-09-12 17:08:25 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 140**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD****DE NACIONAL** 16/09/2007

TIPO DE:

1

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

2

SOLICITANTE
(71)Nombre: **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de Alemania.Dirección: 67056 Ludwigshafen,
AlemaniaDomicilio: Ludwigshafen,
Alemania**IDENTIFICACIÓN**C.C. ☐NIT ☐C.E. ☐Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADONombre: **EMILIO FERRERO**

Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35

Teléfono: 347 36 11

Fax: 211.86 50

E-mail: clientes@cavelier.com

Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓNC.C. ☒NIT ☐C.E. ☐Otro ☐

Cual _____

Número 438.019 T.P 31.929

4

INVENTOR (ES)
(72)1. **Peter SCHÄFER**Römerstrasse 1,
67308 Ottersheim,
Alemania3. **María SCHERER**Hermann-Jürgens-Strasse 30,
76829 Landau,
Alemania5. **Helmut SCHIFFER**Am Hofstück 25,
67483 Grossfischlingen,
Alemania7. **Jochen DIETZ**Spelzenstrasse 2a,
68167 Mannheim,
Alemania9. **Jan Klaas LOHMANN**Lenaustrasse 20,
68167 Mannheim,
Alemania11. **Joachim RHEINHEIMER**Merziger Strasse 24,
67063 Ludwigshafen,
Alemania13. **Anja SCHWÖGLER**Heinrich-Lanz-Strasse 3,
68165 Mannheim,
Alemania2. **Udo HÜNGER**Uhlandstrasse 14,
68167 Mannheim,
Alemania4. **Harald KÖHLE**Am Büschel 13,
67273 Bobenheim,
Alemania6. **Thomas GROTE**Im Höhnhausen 18,
67157 Wachenheim,
Alemania8. **Wassilios GRAMMENOS**Alexander-Fleming-Strasse 13,
67071 Ludwigshafen,
Alemania10. **Bernd MÜLLER**Stockinger Strasse 7,
67227 Frankenthal,
Alemania12. **Frank SCHIEWECK**Burgunderweg 18,
67098 Bad Dürkheim,
Alemania

5

PCT (86)Solicitud Internacional No. PCT/EP2006/050922Fecha: 14 de febrero de 2006Publicación Internacional No. WO 2006/087325 A1Fecha: 24 de agosto de 2006

6

Título (54)

**5-ALCOXIALQUIL-6-ALQUIL-7-AMINO-AZOLOPIRIMIDINAS, UN
PROCEDIMIENTO PARA SU OBTENCION Y EL USO DE LAS MISMAS
PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASI COMO PRODUCTOS QUE
LAS CONTIENEN**

7

Clasificación Internacional (51) C07D 487/004

8

PrioridadSI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

DE

(32) Fecha

16 de febrero de 2005

(31) Número de Solicitud

10 2005 007 157.0

9

Comprobante de pago No.: 07-72,880**Fecha: 10 de septiembre de 2007**

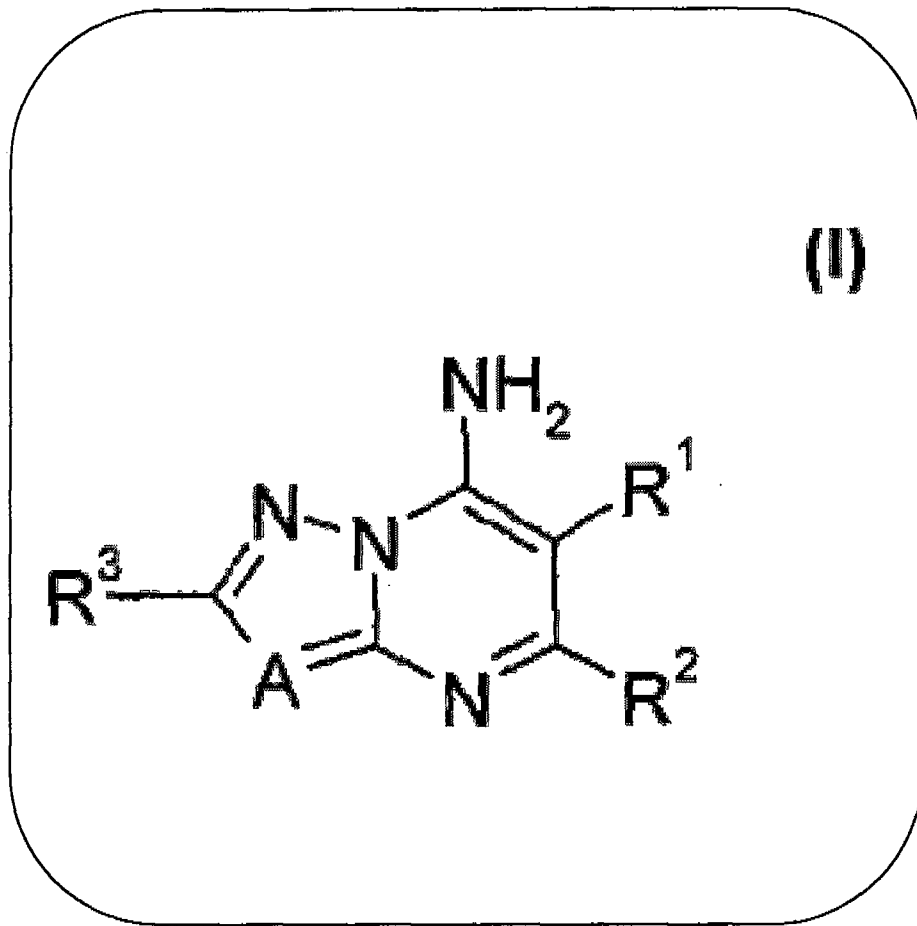
10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 482.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☒ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



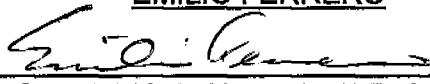
12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :


C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

JGG

A
4**DOCUMENTOS ANEXOS**

1. ☒ Publicación Internacional WO 2006/087325 A1

Descripción:

Páginas 32 en el idioma original

Páginas 46 en español

Reivindicaciones: Número (s) 13

Figuras: Número (s)

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

3. ☒ Traducción Al Español De Los Anexos Presentados Junto Con El Informe Del Examen Preliminar Internacional.

4. ☒ **Forma PCT/IB/306.** Notificación de la inscripción del cambio de dirección del Inventor **Frank SCHIEWECK**

5. ☒ Extracto de publicación.

**SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**

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

REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BASF Aktiengesellschaft

domiciliado (s) en Ludwigshafen, República

Federal de Alemania

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-33, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Consúl de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y enseñanzas; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistirse, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos hechos por agentes oficiales.

Dado y firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

Firma

ppa. Welzel

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, República Federal de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-33, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiliger oder definitiver Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fälle der Hauptvertreter, oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten, oder kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendeten, einer oder anderen, ordnungsgemäss werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise.

Ausserdem, und unter denselben Regeln, wir verleihen den genannten Rechtsanwalte die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu dessen 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-, streitigen Verwaltungs-, und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Service-, Defensiv- und Service-zeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen und -zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Names und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragslizenzen; 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 Mandats erteilen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestreiten.

Unterzeichnet heute am 17. März 1989

in D-6700 Ludwigshafen

Unterschrift

ppa. Richters

1407/89

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

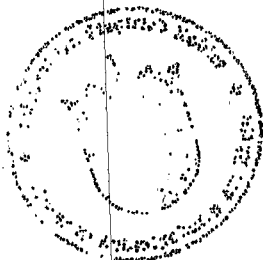
1. Dr. Gunther Weizel, Chemiker in
Ludwigshafen am Rhein,

2. Dr. Peter Richters, Chemiker in
Ludwigshafen am Rhein.

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

aufgrund heutiger Einsichtnahme in das Handelsregister
beim Amtsgericht Ludwigshafen am Rhein HR B 3000 be-
scheine ich, daß die Herren Dr. Weizel 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



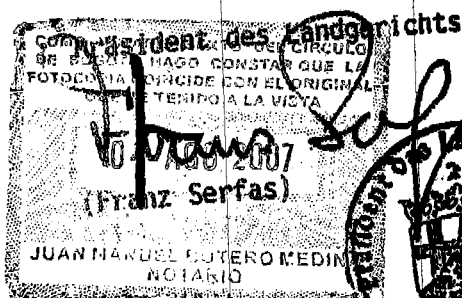
[Handwritten signature]

Th. Walter
als amtlich bestellter Vertreter
des Notars Dr. Gerhard Kohler

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors
Thomas Walter

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

Frankenthal (Pfalz), den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig



Kostenvermerk: Gebühr 20.-- DM



17. März 1989
Notarassessor No. 20

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

Nº - 0077

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

C E R T I F I C A:

Que el señor Thomas Walter-----
quien como Notario en Ludwigshafen am Rhein-----
autenticó la(s) firma(s) del(os) signatario(s) del
Poder precedente, ejercía las funciones indicadas y
su firma corresponde a la registrada ante el Tribunal
Regional 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. Gerhard
WELZEL y el Dr. Peter RICHTERS-----
quien(es) en sus carácter(es) de apoderados-----
----- y cuya(s) firma(s) (fueron) autenticada(s) ante el Notario Thomas Walter-----
----- es(son) su(s) representante(s) legal(es) en este país.

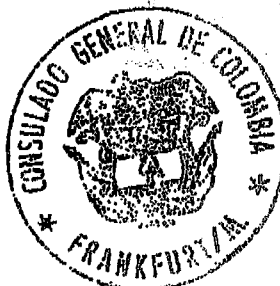
El Cónsul General no asume responsabilidad por el contenido del documento.

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

Frankfurt a. M. 06 ABR 1989

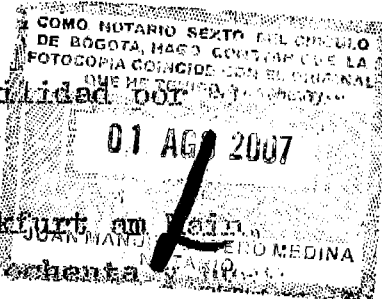
PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por \$45.64 de Ley E. S. N. N.



Nº - 0077

Martha Nino de Serna
Cónsul General de Colombia



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
Bogotá 12 ABR. 1989 No. 8506
HAGO CONSTAR
Martha Nino
cuyo firma aparece al pie del presente
documento, desempeñaba en ese fecha
las funciones de notario

Michael E. Moscoso Acuña
MICHAEL E. MOSCOSO ACUÑA
Jefe de Oficina Generales

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE SE TIENE EN LA
01 AGO 2007
JUAN RAFAEL CORTIJO MEDINA
NOTARIO

88

LEA LAS INSTRUCCIONES
REGLAMENTARIAS QUE TODOS LOS

QUE SE DEBEN ESTAR VALIENDO
CON ALGUN VALOR:

881051599954

B C C 15
SUCURSAL CORPORATIVA

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

① Administración de impuestos de:		Código	② Teléfono
BOGOTA		0,3	2120100
③ Documento de identificación (marque X)		④ Apellidos y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 90 caracteres)	
G.C. y T.L.	NIT. No.	D.V.	CAVELIER ABOGADOS
C	A y No. 860041367	3	
⑤		⑥ Apellidos y Nombre o Razón Social de las partes (máximo 90 caracteres)	
G.C. y T.L.	NIT. No.	D.V.	FORERO ROCHA JAIME
C X	A No. 19' 301.629		
⑦ Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4)		Municipio	Departamento
Cra. 4a. No. 72-35		BOGOTA	CUNDINAMARCA
⑧		⑨	

TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No. 2056 DE ABRIL 26 DE 1989
PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER
CDLO 0361-52-218-8

REVISADO
SECCION DE NEGOCIOS GENERALES
DE ASUNTOS CONSULARES
DE RELACIONES EXTERIORES

Responsable del pago
Nombre
C.C. No. 19301623

PAGO EN BANCOS FOLIO VALORES	VP
	VS
	IV
	TP

1 037 *** 750.00

CONTRIBUYENTE

COMO NOTARIO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, PAGO CONSTA QUE LA
FOLIO 0361-52-218-8
QUEDANDO A LA VISTA
19 AGO 24 87
JUAN MANUEL FORERO MEDINA
NOTARIO

99

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.-

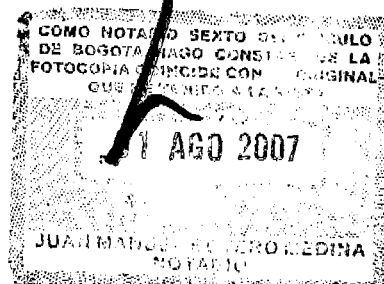
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra. 4 No. 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

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 conocí en persona.



10
10

Certifico, por haber tenido a la vista el registro de comercio HR B 3000, del juzgado de Ludwigshafen, que los doctores Wizer 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

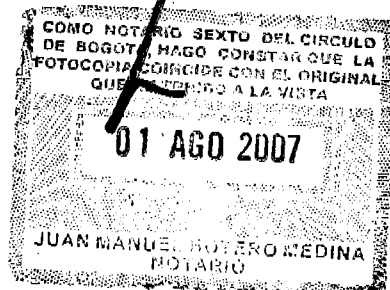
Notario de Ludwigshafen

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

Fdn.: firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20,-- DM

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

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

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

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Ref. ción No. 599 Minutaria

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

Luz Arriaga de Herber

IDENTIFICACION CON C.A. NO. (S)

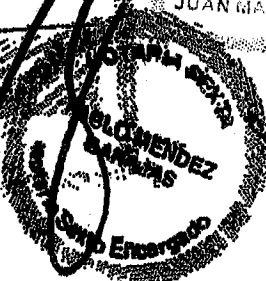
SANTAFE DE BOGOTA

05 AGO. 1999

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

01 AGO 2007

JUAN MANUEL LOTERO MEDINA
NOTARIO



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

LEGALIZACIONES

Mogoró

28 ABR. 1985

No.

89043

HACE CONSTAR

Que el señor

LIZ DE HEREDIA

cuya firma aparece al pie del presente documento, desempeña en esa fecha las funciones allí indicadas.

Generales
División Consular
Encargado

01 AGO 2007

JUAN MANUEL BOUTERO MEDINA
NOTARIO

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

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

CORREO ELECTRONICO: CAVELIER@HOTMAIL.COM
TELÉFONO: 01 (1) 231 7411
CABLE: CAVELIER

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

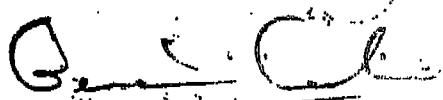
Poderdante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 17-03-89

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

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

Señor Jefe,


GERMAN CAVELIER.

T.P.A. No. 832

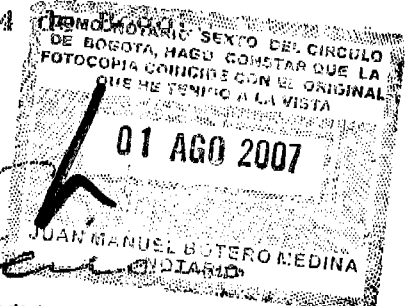
C.C. No. 2.877 924

Acepto:


EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén



DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA
CON PRESENTACION PERSONAL

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

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de Bogotá, compareció, el Doctor EMILIO PERAZA

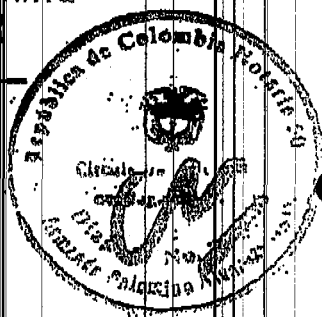
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 428.91
expedida en USA 2004 y la tarjeta profesional
número 21.929 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: D. P. MUÑOZ (C. EXCMO.)
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

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, compareció, el Doctor GERMAN PERAZA

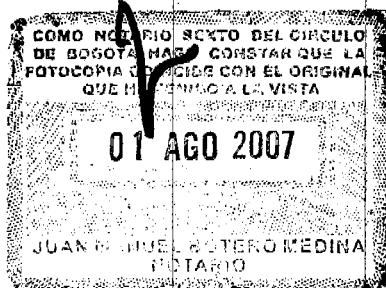
quien exhibió la cédula de ciudadanía número 207292
expedida en 27 y la tarjeta profesional
número 637 del Ministerio de Justicia, con
el presente documento dirigido a: División Nueva Creación
y declaró que la firma que aparece en él es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá, D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



TRADUCCION OFICIAL No. 13095

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

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

Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

Udo Hüniger
Uhlandstr. 14, 68167 Mannheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

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

Harald Köhle
Am Büschel 13, 67273 Bobenheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

Helmut Schiffer
Am Hofstück 25, 67483 Großfischlingen, Alemania
Ciudadano de Alemania

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

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

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

Jan Klaas Lohmann
Lenaustr. 20, 68167 Mannheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

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

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Alemania
Ciudadano de Alemania

Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim, Alemania
Ciudadano de Alemania

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

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

5-ALCOXIALQUIL-6-ALQUIL-7-AMINO-AZOLOPIRIMIDINAS, UN PROCEDIMIENTO PARA SU OBTENCIÓN Y EL USO DE LAS MISMA PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS, ASÍ COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Hay doce firmas ilegibles de los mencionados señores, quedando pendiente la firma del señor Harald Köhle. - Dado y firmado el 18 de enero de 2006 en 67056 Ludwigshafen, Alemania.

Sigue certificación notarial en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer bajo U.R.No. 120/2006 del 18 de enero de 2006. Fdo.: firma ilegible, Hilo y oblea notarial.- Valor: 5.112,92 Euros.

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

LUZ ARRIAGA DE PERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Resolución No.599 Minjusticia

32 - 21

Certificado

- 5. en Frankenthal (Pfalz)
- 6. el 09 de febrero de 2006
- 7. por el Presidente del Tribunal Regional
- 8. bajo el No. 91 Eb - 186/06
- 9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

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

Costas:
Derechos 12,00 €

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

Bogotá, 2 de agosto de 2007

C. 2600

Luz Arriaga
Resolución
Luz Arriaga
b41370
Luz Arriaga
NO SE CONSIDERA
RESPONSABILIDAD
DEL FIRMANTE

obsoluto

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

Luz Arriaga de Heber

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL(LOS) EN ESTA NOTARIA
SANTA FE DE BOGOTA

09 AUG 2007



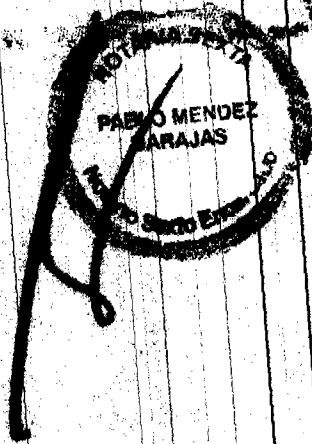
TRADUCCIÓN OFICIAL 180/2007 DE UN DOCUMENTO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL AUTORIZADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE COLOMBIA. DE ACUERDO CON DICHO DOCUMENTO LOS ABAJO FIRMANTES, A SABER PETER SCHÄFER, ROMERSTR. 1 67308 OTTERSHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN, UDO HÜNGER UHLANDSTR. 14 68167 MANNHEIM ALEMANIA CIUDADANO ALEMAN; MARIA SCHERER HERMANN-JÜRGENS-STR. 30, LANDAU ALEMANIA, CIUDADANA ALEMANA; HARALD KÖHLE AM BÜSCHEL 13, 67273 BOBENHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMAN; HELMUT SCHIFFER AM HOFSTÜCK 25, 67483 GROSSFISCHLINGEN ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; THOMAS GROTE IM HÖHNHAUSEN 18, 67157, WACHENHEIM ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; MOCHEN DIETZ SPELZENSTR. 2ª, 68167 MANNHEIM,, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; WASSILIOS GRAMMENOS, ALEXANDER-FLEMING-STR. 13, 67071 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, CIUDADANO GRIEGO; JAN KLAAS LOHMANN LENAUSTR. 20, 68167 MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; BERND MÜLLER, STOCKINGER STR. 7, 67227 FRANKENTHAL ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; JOACHIM RHEINHEIMER MERZIGER STR. 24 67063 LUDWIGSHAVEN ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN; FRANK SCHIEWECK LINDENWEG 4, 67258 HESSHEIM ALEMANIA, CIUDADANO ALEMÁN Y ANJA SCHWÖGLER, HEINRICH-LANZ-STR.3, 68165, MANNHEIM ALEMANIA, CIUDADANO DE ALEMANIA DECLARAMOS BAJO JURAMENTO SER LOS INVENTORES ÚNICOS Y VERDADEROS DE LA INVENCION **5-ALCOXIALQUIL-6-ALQUIL-7-AMINO-AZOLOPIRIMIDINAS**, UN PROCEDIMIENTO PARA SU OBTENCIÓN Y EL USO DE LAS MISMAS PARA COMBATIR HONGOS NOCIVOS ASÍ COMO PRODUCTOS QUE LAS CONTIENEN ADEMÁS QUE CEDEN SIN RESERVAS NI LIMITACIONES EN FAVOR DE **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**, UNA SOCIEDAD CONSTITUIDA Y EXISTENTE DE CONFORMIDAD CON LAS LEYES DE ALEMANIA, DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, TODOS LOS DERECHOS INHERENTES A DICHA INVENCION Y QUE LA CITADA COMPAÑÍA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR

COMO NOTARIO SEXTO DE CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE

Eduardo Cabada
Procurador

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

09 AUG 2007



94/ 24
21

APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document
has been signed by LISA G. STEWART
3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS
CRAIG OLIVE, REGISTER OF DEEDS
4. bears the seal/stamp of COUNTY OF JOHNSTON, NORTH CAROLINA

CERTIFIED

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 12TH DAY OF JANUARY, 2006
7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 786
9. Seal/Stamp



10. Signature

Redueys Maddox



Post Office Box 118 • Smithfield, NC 27577 • Telephone: (919) 989-5160 • Fax: (919) 989-5728

CERTIFICATION OF NOTARY

**State of North Carolina
Johnston County**

I, Craig Olive, Register of Deeds of the aforesaid County and State, do
certify that Heidi V. Sullivan, at the time of signing
this document was a duly commissioned Notary Public in and for the
County of Johnston, State of North Carolina. In Witness Whereof, I
have hereunto set my hand and affixed my official seal.

This 28 day of Dec 2005.

**Craig Olive
Register of Deeds
Johnston County**



By: Lisa A. Stewart
Deputy / Assistant / Register of Deeds

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

Peter Schäfer
Römerstr.1, 67308 Ottersheim
Germany
Citizen of Germany

Udo Hüniger
Uhlandstr. 14, 68167 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

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

Harald Köhle
Am Büschel 13, 67273 Bobenheim
Germany
Citizen of Germany

Helmut Schiffer
Am Hofstück 25, 67483 Großfischlingen
Germany
Citizen of Germany

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

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

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

Jan Klaas Lohmann
Lenastr. 20, 68167 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

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

27
27

domiciliado(s) en

Joachim Rheinheimer
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany

Frank Schieweck
Lindenweg 4, 67258 Heßheim
Germany
Citizen of Germany

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

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

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

5-Alkoxyalkyl-6-alkyl-7-aminoazolopyrimidines, process
for their preparation, and their use for controlling harmful
fungi, and compositions comprising them

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

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

constituida y existente de conformidad con las leyes de

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Germany

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

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

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

31
31

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 08.06/07a realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia, registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento de cesión marcado con el número 0000056351 por medio de la cual los inventores relacionados en la misma transfieren todos sus derechos sobre la invención titulada "5-Alcoxialquil-6-alquil-7-amino-azolopirimidinas, un procedimiento para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen" a favor de **BASF Aktiengesellschaft**, una sociedad constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania y domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania.

Aparece la firma de Harald Köhle.

Estado de Carolina del Norte)
) Declaración Juramentada:
Condado de Durham)

Yo, *Hiedi V. Sullivan*, Notario Público de dicho Condado y Estado, por el presente certifico que **HARALD KOEHLE** compareció personalmente ante mí el día de hoy y reconoció la debida suscripción del anterior instrumento.

TESTIFICA mi firma y sello oficial

Hoy 21 de Diciembre de 2005

Firma Ilegible
Notario Público

Mi Comisión Vence Junio 11 de 2008

Condado de Johnston

Craig Olive

Registrador de Escrituras

Casilla Postal 118 * Smithfield, NC 27577 * Teléfono: (919) 989-5160 * Fax: (919) 989-5728

CERTIFICACIÓN DE NOTARIO

Estado de Carolina del Norte

Condado de Johnston

Yo, Craig Olive, Registrador de Escrituras del anterior Condado de
Estado, por el presente certifico que Heidi V Sullivan, al
momento de firmar este documento era un Notario Público debidamente
comisionada en y para el Condado de Johnston, Estado de Carolina del
Norte. En testimonio de lo cual, al presente he firmado y fijado mi
sello de oficio. Hoy 28 de Diciembre de 2005.

Craig Olive

Registrador de Escrituras

Condado de Johnston

POR Firma Ilegible
Registrador de Escrituras Suplente

APOSTILLA

(Convention de La Haya du 5 octobre 1961)

1. PAÍS: ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA

Este documento público

2. ha sido firmado por LISA G. STEWART

3. actuando en calidad de REGISTRADOR DE ESCRITURAS SUPLENTE

CRAIG OLIVE, REGISTRADOR DE ESCRITURAS

4. lleva el sello/estampilla de CONDADO DE JOHNSTON, CAROLINA DEL NORTE

CERTIFICADO

5. En Raleigh, Carolina del Norte

6. El 12 DE ENERO DE 2006

7. por el Suplente del Secretario de Estado, Estado de Carolina del Norte

8. No. 786

9. Sello/estampilla:

10. Firma



Firma ilegible

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta
oficina para su confrontación.

DVZ/ID-8846/WPCL002G/COLO 00361-841-165-0

DIEGO F. VARGAS

TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL

ESPAÑOL - INGLÉS - INGLÉS - ESPAÑOL

RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999

MINISTERIO DE JUSTICIA

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

Diego Felipe Nolasco

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

06 AUG 2007

COPIA DEL CIRCULO



(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
24. August 2006 (24.08.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/087325 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 487/04 (2006.01) A01N 43/90 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2006/050922

(22) Internationales Anmeldedatum:

14. Februar 2006 (14.02.2006)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

10 2005 007 157.0

16. Februar 2005 (16.02.2005) 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): SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr. 1, 67308 Ottersheim (DE). HÜNGER, Udo [DE/DE]; Uhlandstr. 14, 68167 Mannheim (DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str. 30, 76829 Landau (DE). KÖHLE, Harald [DE/DE]; Am Büschel 13, 67273 Bobenheim (DE). SCHIFFER, Helmut [DE/DE]; Am Hofstück 25, 67483 Grossfischlingen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hühnhäusen 18, 67157 Wachenheim (DE). DIETZ, Jochen [DE/DE]; Spelzenstr. 2a, 68167 Mannheim (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]; Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). LOHMANN, Jan, Klaas [DE/DE];

Lenastr. 20, 68167 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE).

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

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

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

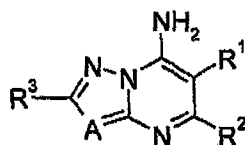
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 5-ALKOXYALKYL-6-ALKYL-7-AMINO-AZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION, THEIR USE FOR CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID SUBSTANCES

(54) Bezeichnung: 5-ALKOXYALKYL-6-ALKYL-7-AMINO-AZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



said compounds, to agents containing the latter and to their use for controlling plant-pathogenic fungi.

(57) Zusammenfassung: 5-Alkoxyalkyl-6-alkyl-7-amino-azolopyrimidine der Formel (I) in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R¹ Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Cyanoalkyl und Benzyloxyalkyl, wobei die Gruppen im aliphatischen oder aromatischen Teil unsubstituiert oder durch eine bis drei Gruppen R^a substituiert sein können: R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkylthio und NR^aR^b, R^a, R^b Wasserstoff und Alkyl; R² Alkoxyalkyl, Phenoxyalkyl, Alkylthioalkyl und Phenylthioalkyl, welche Gruppen unsubstituiert oder gemäß der Beschreibung substituiert sein können; R³ Wasserstoff und Alkyl; A N und C-R^a; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

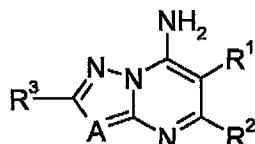
34
8A

5-Alkoxyalkyl-6-alkyl-7-aminoazolopyrimidines, process for their preparation, their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising them

Description

5

The present invention relates to 5-alkoxyalkyl-6-alkyl-7-aminoazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are defined as follows:

10

R¹ is C₁-C₁₂-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₂-C₁₂-alkenyl, C₂-C₁₂-alkynyl, C₂-C₁₂-alkoxyalkyl, C₂-C₁₂-cyanoalkyl, and C₈-C₁₉-benzyloxyalkyl, where the groups in the aliphatic or aromatic moiety may be unsubstituted or may have substitution by from one to three groups R^a;

15

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxy, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkylthio, and NR^AR^B;
R^A, R^B are hydrogen and C₁-C₆-alkyl;

20

R² is C₁-C₁₂-alkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, phenoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-alkylthio-C₁-C₁₂-alkyl, and phenylthio-C₁-C₁₂-alkyl, in which groups the carbon chains can have substitution by from one to three groups R^a, and the phenyl rings can have substitution by from one to five substituents composed of C₁-C₆-alkyl or of a group R^a;

25

R³ is hydrogen and C₁-C₆-alkyl;

A is N and C-R^A.

30

The invention also relates to processes for preparation of these compounds, compositions comprising them, and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

5,6-Dialkyl-7-aminotriazolopyrimidines are proposed generally in GB 1 148 629.

35

Individual fungicidal 5,6-dialkyl-7-aminoazolopyrimidines are disclosed in EP-A 141 317. However, their activity is unsatisfactory in many instances. Starting from this point, an object underlying the present invention is to provide compounds with improved activity and/or with a broader activity spectrum.

Accordingly, the compounds defined at the outset have been found. Processes and intermediates for their production have moreover been found, as have compositions comprising them, and also methods for controlling harmful fungi, using the compounds I.

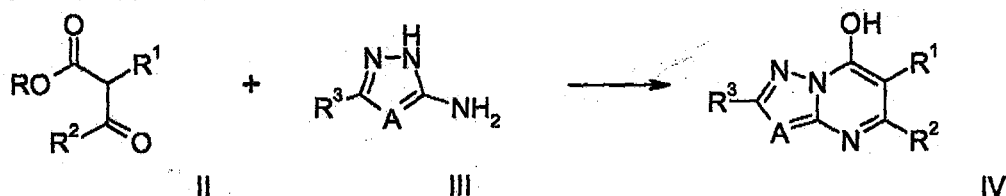
5

The compounds of the formula I differ from those from the abovementioned specifications by virtue of the specific design of the substituent in the 5-position of the triazolopyrimidine skeleton.

- 10 The compounds of the formula I have increased activity against harmful fungi when compared with the known compounds.

The inventive compounds can be obtained in various ways. The inventive compounds are advantageously obtained by reacting substituted β -ketoesters of the formula II with 3-amino-1,2,4-triazole or -pyrazole of the formula III to give 7-hydroxyazolopyrimidines of the formula IV. The groups R^1 and R^2 in formulae II and IV are defined as for formula I, and the group R in formula II is C_1 - C_4 -alkyl, preference being given here to methyl, ethyl, or propyl for practical reasons.

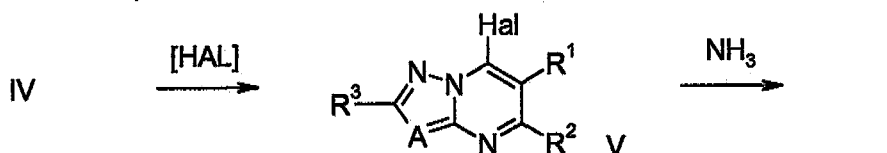
15



- 20 The reaction of the substituted β -ketoesters of the formula II with the aminoazoles of the formula III can be carried out in the presence or absence of solvents. It is advantageous to use solvents to which the starting materials are substantially inert and in which they are completely or to some extent soluble. Particular solvents which may be used are alcohols such as ethanol, propanols, butanols, glycols, or glycol
- 25 monoethers, diethylene glycols or their monoethers, aromatic hydrocarbons such as toluene, benzene, or mesitylene, amides, such as dimethylformamide, diethylformamide, dibutylformamide, N,N -dimethylacetamide, lower alkane acids, such as formic acid, acetic acid, propionic acid, or bases, such as alkali metal hydroxides and alkaline earth metal hydroxides, alkali metal oxides and alkaline earth metal
- 30 oxides, alkali metal hydrides and alkaline earth metal hydrides, alkali metal amides, alkali metal carbonates and alkaline earth metal carbonates, and also alkali metal hydrogencarbonates, organometallic compounds, in particular alkali metal alkyl compounds, alkylmagnesium halides, and also alkali metal alcoholates and alkaline earth metal alcoholates, and dimethoxymagnesium, and also organic bases, e.g.
- 35 tertiary amines such as trimethylamine, triethylamine, triisopropylethylamine, tributylamine, and N -methylpiperidine, N -methylmorpholine, pyridine, substituted pyridines, such as collidine, lutidine, and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic amines and mixtures of these solvents with water. Catalysts which may be used are

bases, as mentioned above, or acids, such as sulfonic acid or mineral acids. The reaction is particularly preferably carried out without solvent or in chlorobenzene, xylene, dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone. Particularly preferred bases are tertiary amines, such as triisopropylamine, tributylamine, N-methylmorpholine, or N-methylpiperidine. The temperatures are from 50 to 300°C, preferably from 50 to 180°C, if preparations are carried out in solution [cf. EP-A 770 615; Adv. Het. Chem. vol. 57, pp. 81 et seq. (1993)].

The amounts used of the bases are generally catalytic amounts, but the bases may also be used in equimolar amounts, or in excess or, if appropriate, as solvents.

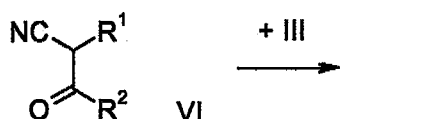


The resultant condensates of the formula IV mostly precipitate in pure form from the reaction solutions, and, after washing with the same solvent or with water and subsequent drying, are reacted with halogenating agents, in particular chlorinating or brominating agents, to give the compounds of the formula V, in which Hal is chlorine or bromine, in particular chlorine. The reaction preferably takes place with chlorinating agents, such as phosphorus oxychloride, thionyl chloride, or sulfuryl chloride, at from 50°C to 150°C, preferably in excess phosphorus oxytrichloride at reflux temperature. Once the excess phosphorus oxytrichloride has been evaporated, the residue is treated with iced water, if appropriate with addition of a solvent immiscible with water. The chlorination product isolated from the dried organic phase, if appropriate after evaporation of the inert solvent, is mostly very pure and is then reacted with ammonia in inert solvents at from 100°C to 200°C to give the 7-aminoazolo[1,5-a]pyrimidines. The reaction is preferably carried out with a from 1- to 10-molar excess of ammonia under a pressure of from 1 to 100 bar.

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

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

As an alternative, the novel compounds of the formula I may be obtained by reacting substituted acyl cyanides of the formula VI, in which R¹ and R² are defined as stated above, with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III.



37
37

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

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

The substituted alkyl cyanides of the formula VI needed for preparation of the 7-aminoazolo[1,5-a]pyrimidines are to some extent known, or can be prepared by known methods from alkyl cyanides and carboxylic esters with strong bases, e.g. alkali metal hydrides, alkali metal alcoholates, alkali metal amides, or metal alkyl compounds [cf.: J. Amer. Chem. Soc. vol. 73, (1951) p. 3766].

To the extent that individual compounds I are not accessible by the routes described above, they can be prepared via derivatization of other compounds I.

The extent that isomer mixtures are produced in the synthesis, separation is not generally an essential requirement, because the individual isomers can convert into one another to some extent during procedures for use or during use (e.g. on exposure to light, to acid, or to base). Corresponding conversions can also take place after use, for example during the treatment of plants within the treated plant or within the harmful fungus to be controlled.

The definitions given for the symbols in the above formulae are collective terms which provide general representation for the following substituents:

Halogen: fluorine, chlorine, bromine, and iodine;

alkyl: saturated, straight-chain or singly or doubly branched hydrocarbon radicals having from 1 to 4 or from 5 to 12 carbon atoms, e.g. C₁-C₈-alkyl, such as methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, n-pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-di-

methylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl, and 1-ethyl-2-methylpropyl;

halomethyl: a methyl group in which the hydrogen atoms may have been replaced to some extent or completely by halogen atoms as mentioned above: particularly chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl;

cycloalkyl: mono- or bicyclic, saturated hydrocarbon groups having from 3 to 6 carbon ring members, e.g. cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, and cyclohexyl;

alkoxyalkyl: saturated, straight-chain or singly, doubly, or triply branched hydrocarbon chain interrupted by an oxygen atom, e.g. C₅-C₁₂-alkoxyalkyl: hydrocarbon chain as described above which has from 5 to 12 carbon atoms and which can have interruptions by an oxygen atom at any desired point, e.g. propoxyethyl, butoxyethyl, pentoxyethyl, hexyloxyethyl, heptyloxyethyl, octyloxyethyl, nonyloxyethyl, 3-(3-ethylhexyloxy)ethyl, 3-(2,4,4-trimethylpentyloxy)ethyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)ethyl, ethoxypropyl, propoxypropyl, butoxypropyl, pentoxypropyl, hexyloxypropyl, heptyloxypropyl, octyloxypropyl, nonyloxypropyl, 3-(3-ethylhexyloxy)propyl, 3-(2,4,4-trimethylpentyloxy)propyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)propyl, ethoxybutyl, propoxybutyl, butoxybutyl, pentoxybutyl, hexyloxybutyl, heptyloxybutyl, octyloxybutyl, nonyloxybutyl, 3-(3-ethylhexyloxy)butyl, 3-(2,4,4-trimethylpentyloxy)butyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)butyl, methoxypentyl, ethoxypentyl, propoxypentyl, butoxypentyl, pentoxy-pentyl, hexyloxy-pentyl, heptyloxy-pentyl, 3-(3-methylhexyloxy)pentyl, 3-(2,4-dimethylpentyloxy)pentyl, 3-(1-ethyl-3-methylbutoxy)pentyl.

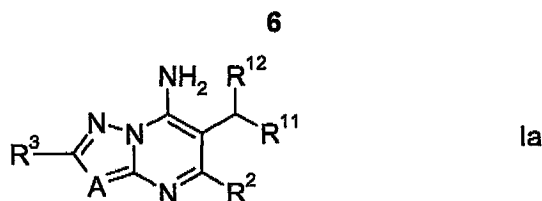
For the purposes of the present invention, the (R) and (S) isomers and the racemates of compounds of the formula I that have chiral centers are included.

The following definitions of the substituents, in each case alone or in combination, are particularly preferred for the appropriate use of the azolopyrimidines of the formula I:

Preference is given to compounds I in which the group R¹ has at most 12 carbon atoms.

The alkyl groups in R¹ in formula I are preferably unbranched or singly, doubly, or triply branched, or multibranched groups, in particular an unbranched C₁-C₁₂-alkyl group.

Alongside this, preference is given to compounds of the formula I which have branching at the α -carbon atom in R¹. They are described by formula Ia

39
39

- in which R^{11} is C_3 - C_{10} -alkyl or C_5 - C_{10} -alkoxyalkyl, and R^{12} is C_1 - C_4 -alkyl, in particular methyl, where R^{11} and R^{12} together have not more than 12 carbon atoms and are unsubstituted or can have substitution as R^1 in formula I, and other variables are defined as for formula I.

- To the extent that R^1 is a cyano-substituted alkyl group, the cyano group is preferably on the terminal carbon atom.
- 10 To the extent that R^1 is a halo-substituted alkyl group, the halogenation is preferably present at the α - or at the ω -carbon atom.

In another preferred embodiment, R^1 is a hydroxy-substituted alkyl group.

- 15 Preference is given to compounds I in which R^1 is an unbranched or singly, doubly or triply branched, or multibranched C_5 - C_{12} -alkyl group or C_5 - C_{10} -alkoxypropyl group which bears no further substituents.

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

- 25 Preference is also given to compounds of the formula I in which R^1 is n-heptyl, 1-methylhexyl, n-octyl, 1-methylheptyl, n-nonyl, 1-methyloctyl, 3,5,5-trimethylhexyl, n-decyl, 1-methylnonyl, n-undecyl, 1-methyldecyl, n-dodecyl, and 1-methylundecyl.

- 30 In another preferred embodiment of the inventive compounds, R^1 is methoxy-n-propyl, ethoxy-n-propyl, n-propoxy-n-propyl, n-butoxy-n-propyl, n-pentyloxy-n-propyl, n-hexyloxypropyl, n-heptyloxy-n-propyl, n-octyloxy-n-propyl, n-nonyloxy-n-propyl or n-decyl-oxy-n-propyl.

- 35 In one preferred embodiment of the inventive compounds I, R^2 is C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, in particular C_1 - C_{12} -alkoxymethyl.

In another preferred embodiment, R^2 is methoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, in particular methoxymethyl.

40

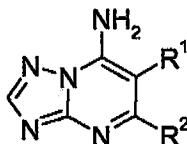
In one preferred embodiment of the inventive compounds I, A is a nitrogen atom.

In another embodiment of the compounds I, A is CR⁴, in particular CH.

5

Preference is also given to compounds I in which R³ is hydrogen.

One particularly preferred embodiment of the inventive compounds of the formula I is provided by those of the formula I.A:



I.A

10

in which R¹ and R² are defined as for formula I, where R¹ is in particular C₁-C₁₂-alkyl and R² is in particular C₂-C₁₂-alkoxymethyl, preferably methoxymethyl.

15

With respect to their use, particular preference is given to the compounds I collated in the tables below. The groups mentioned for a substituent in the tables are moreover per se a particularly preferred embodiment of the relevant substituent, irrespective of the combination within which they have been mentioned.

Table 1

20

Compounds of the formula I.A in which R¹ is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R² is methoxymethyl

Table 2

25

Compounds of the formula I.A in which R¹ is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R² is ethoxymethyl

Table 3

30

Compounds of the formula I.A in which R¹ is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R² is n-propoxymethyl

Table 4

Compounds of the formula I.A in which R¹ is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R² is methoxyethyl

35

Table 5

Compounds of the formula I.A in which R¹ is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R² is ethoxyethyl

41

Table 6

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R^2 is n-propoxyethyl.

5 Table 7

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R^2 is 3-methoxy-n-propyl

Table 8

- 10 Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R^2 is 3-ethoxy-n-propyl

Table 9

- 15 Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, and R^2 is 3-n-propoxy-n-propyl

Table 10

- 20 Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is methoxymethyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

Table 11

- Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is ethoxymethyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

25 Table 12

Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is n-propoxymethyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

Table 13

- 30 Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is methoxyethyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

Table 14

- 35 Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is ethoxyethyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

Table 15

- 40 Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is n-propoxyethyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

42
42

Table 16

Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is 3-methoxy-n-propyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

5 Table 17

Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is 3-ethoxy-n-propyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

Table 18

- 10 Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is 3-n-propoxy-n-propyl, R^3 is hydrogen, and A is CH

Table 19

- 15 Compounds of the formula I in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is methoxymethyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

Table 20

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is ethoxymethyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

20 Table 21

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is n-propoxymethyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

Table 22

- 25 Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is methoxyethyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

Table 23

- 30 Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is ethoxyethyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

Table 24

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is n-propoxyethyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

35

Table 25

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is 3-methoxy-n-propyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

43
93

Table 26

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is 3-ethoxy-n-propyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

5 Table 27

Compounds of the formula I.A in which R^1 is a compound in each case corresponding to one line of Table A, R^2 is 3-n-propoxy-n-propyl, R^3 is CH_3 , and A is CH

Table A

No.	R^1
A-1	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-2	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-3	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-4	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-5	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-6	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_3$
A-7	$CH(CH_3)CH(CH_3)_2$
A-8	$CH_2C(CH_3)_3$
A-9	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-10	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-11	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-12	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-13	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2CH_2$
A-14	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-15	$CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-16	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
A-17	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
A-18	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-19	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-20	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-21	$CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-22	$CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
A-23	$CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-24	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$
A-25	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2$

44
41

No.	R ¹
A-26	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-27	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-28	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-29	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-30	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-31	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-32	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-33	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-34	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-35	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-36	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-37	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-38	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-39	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-40	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-41	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-42	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-43	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-44	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-45	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-46	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-47	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-48	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-49	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-50	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-51	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-52	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-53	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-54	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-55	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-56	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-57	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

49

No.	R'
A-186	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-187	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-188	Cyclopropyl
A-189	Cyclopentyl
A-190	Cyclohexyl
A-191	$\text{CH}=\text{CH}_2$
A-192	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-193	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-194	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$
A-195	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-196	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-197	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-198	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$
A-199	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-200	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-201	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-202	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-203	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-204	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-205	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-206	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-207	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-208	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-209	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-210	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-211	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-212	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-213	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-214	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-215	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-216	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-217	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$

50

No.	R ¹
A-218	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-219	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-220	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-221	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-222	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-223	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-224	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-225	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-226	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-227	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-228	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-229	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-230	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-231	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-232	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-233	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-234	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-235	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-236	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-237	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-238	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-239	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-240	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-241	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-242	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-243	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-244	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-245	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-246	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-247	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-248	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-249	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$

51

No.	R ¹
A-250	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-251	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-252	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-253	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-254	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-255	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-256	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-257	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-258	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-259	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-260	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-261	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-262	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-263	$\text{C}\equiv\text{CH}$
A-264	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-265	$\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-266	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-267	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-268	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-269	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}\equiv\text{CH}$
A-270	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-271	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-272	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-273	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-274	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-275	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-276	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-277	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-278	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-279	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-280	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-281	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$

53
53

No.	R ¹
A-314	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-315	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-316	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-317	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-318	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-319	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-320	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-321	CH ₂ CH ₂ CN
A-322	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-323	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-324	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-325	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-326	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-327	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-328	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
A-329	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN

The compounds I are suitable as fungicides. They feature excellent activity against a broad spectrum of phytopathogenic fungi from the class of the *Ascomycetes*, *Deuteromycetes*, *Oomycetes*, and *Basidiomycetes*, in particular from the class of the *Oomycetes*. They have to some extent systemic activity that can be used for plant protection in the form of foliar fungicides, seed-dressing fungicides, and soil fungicides.

They are particularly important for the control of a wide variety of fungi on various crop plants, such as wheat, rye, barley, oats, rice, maize, grass, banana, cotton, soybean, coffee, sugar cane, grapevines, fruit plants and ornamentals, and vegetable plants, such as cucumbers, beans, tomatoes, potatoes, and pumpkins, and also on the seed of these plants.

They are specifically suitable for control of the following plant diseases:

- 15 - *Alternaria* species on vegetables, rapeseed, sugar cane, and fruit and rice,
- *Aphanomyces* species on sugar cane and vegetables,
- *Bipolaris* and *Drechslera* species on maize cereals, rice, and lawns,
- *Blumeria graminis* (powdery mildew) on cereals,
- *Botrytis cinerea* (gray mold) on strawberries, vegetables, flowers, and grapevine,
- 20 - *Bremia lactucae* on lettuce,

84
54

- *Cercospora* species on maize, soybean, rice, and sugar cane,
- *Cochliobolus* species on maize, cereals, rice (e.g. *Cochliobolus sativus* on cereals, *Cochliobolus miyabeanus* on rice),
- *Colletotricum* species on soybean and cotton,
- 5 - *Drechslera* species on cereals and maize,
- *Exserohilum* species on maize,
- *Erysiphe cichoracearum* and *Sphaerotheca fuliginea* on cucurbits,
- *Fusarium* and *Verticillium* species on various plants,
- *Gaeumanomyces graminis* on cereals
- 10 - *Gibberella* species on cereals and rice (e.g. *Gibberella fujikuroi* on rice)
- Grainstaining complex on rice,
- *Helminthosporium* species on maize and rice,
- *Microdochium nivale* on cereals,
- *Mycosphaerella* species on cereals, banana, and peanuts,
- 15 - *Phakopsara pachyrhizi* and *Phakopsara meibomia* on soybean,
- *Phomopsis* species on soybean and sunflower,
- *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes,
- *Plasmopara viticola* on grapevine,
- *Podosphaera leucotricha* on apple,
- 20 - *Pseudocercospora herpotrichoides* on cereals,
- *Pseudoperonospora* species on hops and cucurbits,
- *Puccinia* species on cereals and maize,
- *Pyrenophora* species on cereals,
- *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma*
- 25 *oryzae* on rice,
- *Pyricularia grisea* on lawns and cereals,
- *Pythium* spp. on lawns, rice, maize, cotton, rapeseed, sunflower, sugar cane, vegetables, and other plants,
- *Rhizoctonia* species on cotton, rice, potatoes, lawns, maize, rapeseed, sugar cane,
- 30 vegetables, and other plants,
- *Sclerotinia* species on rapeseed and sunflower,
- *Septoria tritici* and *Stagonospora nodorum* on wheat,
- *Erysiphe* (syn. *Uncinula*) *necator* on grapevine,
- *Setosphaeria* species on maize and lawns,
- 35 - *Sphacelotheca reilinia* on maize,
- *Thievaliopsis* species on soybean and cotton,
- *Tilletia* species on cereals,
- *Ustilago* species on cereals, maize, and sugar cane, and
- *Venturia* species (scab) on apple and pear.

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

- 5 The compounds I are moreover suitable for control of harmful fungi in the protection of materials (e.g. wood, paper, dispersions for paint, fibers, or textiles) and in protection of inventories. The following harmful fungi are particularly relevant in the protection of wood: ascomycetes, such as *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma* spp., *Chaetomium* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp.,
- 10 *Trichurus* spp.; basidiomycetes, such as *Coniophora* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp., and *Tyromyces* spp., deuteromycetes, such as *Aspergillus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicillium* spp., *Trichoderma* spp., *Alternaria* spp., *Paecilomyces* spp., and zygomycetes, such as *Mucor* spp., and the following yeasts are also relevant in the protection of materials:
- 15 *Candida* spp., and *Saccharomyces cerevisiae*.

- The compounds I are used by treating the fungi or the materials, seed materials, or plants to be protected from fungal infestation, or the soil, with a fungicidally effective amount of the active ingredients. The use may take place either prior to or else after
- 20 infection of the materials, plants, or seed by the fungi.

The fungicidal compositions generally comprise from 0.1 to 95% by weight, preferably from 0.5 to 90% by weight, of active ingredient.

- 25 The application rates for plant-protection use depend on the desired effect and are from 0.01 to 2.0 kg of active ingredient per hectare.

Amounts of active ingredient needed for treating seed materials are generally from 1 to 1000 g/100 kg, preferably from 5 to 100 g/100 kg of seed materials.

- 30 For use in protection of materials or of inventories, the application rate of active ingredient depends on the nature of the field of use and on the desired effect. By way of example, conventional application rates in protection of materials are from 0.001 g to 2 kg, preferably from 0.005 g to 1 kg of active ingredient per cubic meter of treated
- 35 materials.

The compounds of the formula I can exist in various crystalline forms, the biological activity of which can differ. They are likewise provided by the present invention.

- 40 The compounds I may be converted into the usual formulations, e.g. solutions, emulsions, suspensions, dusts, powders, pastes, and granules. The usage form

depends on the particular use intended; it should always provide fine and uniform distribution of the inventive compound.

The formulations are prepared in a known manner, e.g. by extending the active ingredient with solvents and/or carrier substances, if desired with use of emulsifiers and dispersing agents. Solvents/auxiliaries which may be used for this purpose are in essence:

- water, aromatic solvents (e.g. Solvesso products, xylene), paraffins (e.g. petroleum fractions), alcohols (e.g. methanol, butanol, pentanol, benzyl alcohol), ketones (e.g. cyclohexanone, gamma-butyrolactone), pyrrolidones (NMP, NOP), acetates (glycol diacetate), glycols, dimethyl fatty acid amides, fatty acids, and fatty acid esters. In principle it is also possible to use solvent mixtures,
- carrier substances such as ground naturally occurring minerals (e.g. kaolins, aluminas, talc, chalk) and ground synthetic minerals (e.g. fine-particle silica, silicates); emulsifiers, such as nonionic and anionic emulsifiers (e.g. polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates, and arylsulfonates), and dispersing agents, such as lignosulfites and methylcellulose.

Surfactants which may be used are the lignosulfonate of alkali metals, of alkaline earth metals, and of ammonium, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutylnaphthalenesulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates, fatty acids, and sulfated fatty alcohol glycol ethers, and also condensates of sulfonated naphthalene and of naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and formaldehyde, polyoxyethylene octylphenol ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ether, 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.

To produce directly sprayable solutions, emulsions, pastes, or oil dispersions, use may be made of mineral oil fractions of moderate to high boiling point, e.g. kerosene or diesel oil, and also coal tar oils and oils of vegetable or animal origin, aliphatic, cyclic, and aromatic hydrocarbons, e.g. toluene, xylene, paraffin, tetrahydronaphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol, ethanol, propanol, butanol, cyclohexanol, cyclohexanone, isophorone, or high-polarity solvents, e.g. dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone, or water.

Pulverulent compositions, spreadable compositions, and dustable compositions can be produced by mixing the active substances in a solid carrier or grinding these together.

- Granules, for example produced by encapsulation or impregnation, and homogeneous granules, may be produced via binding of the active ingredients to solid carrier substances. Examples of solid carrier substances are minerals, such as silica gels, silicates, talc, kaolin, Attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate and magnesium sulfate, magnesium oxide, ground plastics, fertilizers, e.g. ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, ureas, and plant-derived products, such as cereal meal, ground tree bark, wood flour, and nutshell flour, cellulose powder, and other solid carrier substances.
- 10 The formulations generally comprise from 0.01 to 95% by weight, preferably from 0.1 to 90% by weight, of the active ingredient. The purity at which the active ingredients are used here is from 90% to 100%, preferably from 95% to 100% (by NMR spectrum).

Examples of formulations are: 1. Products for dilution in water

15

A Water-soluble concentrates (SL, LS)

- 10 parts by weight of the active ingredients are dissolved using 90 parts by weight of water or of a water-soluble solvent. As an alternative, wetting agents or other auxiliaries are added. The active ingredient dissolves on dilution in water. The result is a formulation whose active ingredient content is 10% by weight.

B Dispersible concentrates (DC)

- 20 parts by weight of the active ingredients are dissolved in 70 parts by weight of cyclohexanone, with addition of 10 parts by weight of a dispersing agent, e.g. polyvinylpyrrolidone. A dispersion is produced on dilution in water. The active ingredient content is 20% by weight.

C Emulsifiable concentrates (EC)

- 15 parts by weight of the active ingredients are dissolved in 75 parts by weight of xylene, with addition of Ca dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5 parts by weight). An emulsion is produced on dilution in water. The active ingredient content of the formulation is 15% by weight.

D Emulsions (EW, EO, ES)

- 25 parts by weight of the active ingredients are dissolved in 35 parts by weight of xylene, with addition of Ca dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylates (in each case 5 parts by weight). This mixture is added to 30 parts by weight of water by means of an emulsifying machine (Ultra-Turrax), and converted to a homogeneous emulsion. An emulsion is produced on dilution in water. The active ingredient content of the formulation is 25% by weight.

58

E Suspensions (SC, OD, FS)

- 20 parts by weight of the active ingredients are comminuted in a stirred ball mill, with addition of 10 parts by weight of dispersing agents and wetting agents and of 70 parts by weight of water or an organic solvent, to give a fine suspension of active ingredient.
- 5 A stable suspension of the active ingredient is produced on dilution in water. The active ingredient content of the formulation is 20% by weight.

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

- 50 parts by weight of the active ingredients are finely ground, with addition of 50 parts by weight dispersing agents and wetting agents, and technical equipment (e.g. extrusion, spray tower, fluidized bed) is used to produce water-dispersible or water-soluble granules therefrom. A stable dispersion or solution of the active ingredient is produced on dilution in water. The active ingredient content of the formulation is 50% by weight.

15

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

- 75 parts by weight of the active ingredients are milled in a rotor-stator mill, with addition of 25 parts by weight of dispersing agents and wetting agents, and also silica gel. A stable dispersion or solution of the active ingredient is produced on dilution in water.
- 20 The active ingredient content of the formulation is 75% by weight.

H Gel formulations

- 20 parts by weight of the active ingredients, 10 parts by weight of dispersing agents, 1 part by weight of gelling agent, and 75 parts by weight of water or of an organic solvent are milled in a ball mill to give a fine suspension. A stable suspension with 20% by weight active ingredient content is produced on dilution with water.

25

2. Products for direct application**30 I Dusts (DP, DS)**

- 5 parts by weight of the active ingredients are finely ground and intimately mixed with 95 parts by weight of fine-particle kaolin. This gives a dustable product whose active ingredient content is 5% by weight.

35 J Granules (GR, FG, GG, MG)

- 0.5 part by weight of the active ingredients is finely ground and associated with 99.5 parts by weight of carriers. Familiar processes here are extrusion, spray drying, or fluidized bed. This gives granules for direct application whose active ingredient content is 0.5% by weight.

40

K ULV solutions (UL)

- 10 parts by weight of the active ingredients are dissolved in 90 parts by weight of an

87
59

organic solvent, e.g. xylene. This gives a product for direct application whose active ingredient content is 10% by weight.

- For seed treatment it is usual to use water-soluble concentrates (LS), suspensions (FS), dusts (DS), water-dispersible and water-soluble powders (WS, SS), emulsions (ES), emulsifiable concentrates (EC), and gel formulations (GF). These formulations can be used in undiluted or preferably diluted form on the seed. Useage can precede sowing.
- 10 The active ingredients may be used as they stand, or in the form of their formulations, or in the form of usage forms prepared therefrom, e.g. in the form of directly sprayable solutions, powders, suspensions or dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dusting compositions, spreading compositions, granules via spraying, misting, dusting, spreading, or pouring. The usage forms are entirely dependent on the intended uses;
- 15 wherever possible they should always ensure maximum fineness of dispersion of the inventive active ingredients.

- Aqueous usage forms can be prepared from emulsion concentrates, from pastes, or from wettable powders (oil dispersions) via addition of water. To prepare emulsions, pastes, or oil dispersions, the substances as they stand or dissolved in an oil or solvent may be homogenized in water by using wetting agents, tackifiers, dispersing agents, or emulsifiers. However, it is also possible to prepare concentrates composed of active substance, wetting agent, tackifier, dispersing agent, or emulsifier, and possibly solvent or oil, these concentrates being suitable for dilution with water.

- 25 The concentrations of active ingredient in the ready-to-use preparations can be varied within relatively wide ranges. They are generally from 0.0001 to 10%, preferably from 0.01 to 1%.

- 30 The active ingredients can also be used very successfully in ultralow-volume methods (ULM), and it is possible here to apply formulations with more than 95% by weight of active ingredient, or even to apply the active ingredient without additives.

- 35 Materials which may be added to the active ingredients are oils of various type, wetting agents, adjuvants, herbicides, fungicides, other pest-control compositions, and bactericides, and addition of these may, if appropriate, also be deferred until immediately prior to use (tank mix). These agents can be admixed in a ratio by weight of from 1:100 to 100:1, preferably 1:10 to 10:1, with the inventive materials.

- 40 Particular adjuvants that can be used here are: organically modified polysiloxanes, e.g. Break Thru S 240[®]; alcohol alkoxylates, e.g. Atplus 245[®], Atplus MBA 1303[®], Plurafac LF 300[®], and Lutensol ON 30[®]; EO-PO block polymerisates, e.g. Pluronic RPE 2035[®],

and Genapol B®; alcohol ethoxylates, e.g. Lutensol XP 80®; and sodium dioctyl sulfosuccinate, e.g. Leophen RA®.

- 5 The inventive materials can also be present in the usage form as fungicides together with other active ingredients, e.g. with herbicides, insecticides, growth regulators, fungicides, or else with fertilizers. When compounds I or compositions comprising them in the usage form as fungicides are mixed with other fungicides, the result in many instances is an enlargement of the fungicidal activity spectrum.
- 10 The following lists of fungicides with which the inventive compounds may be jointly used is intended to illustrate, but not restrict, the possibilities for combination:

Strobilurins

- 15 azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, trifloxystrobin, orysastrobin, methyl (2-chloro-5-[1-(3-methylbenzyloxyimino)ethyl]benzyl)carbamate, methyl (2-chloro-5-[1-(6-methylpyridin-2-ylmethoxyimino)ethyl]benzyl)carbamate, methyl 2-(ortho-(2,5-dimethylphenyl)oxymethylene)phenyl-3-methoxyacrylate;

20 Carboxamides

- carboxanilides: benalaxyl, benodanil, boscalid, carboxin, mepronil, fenfuram, fenhexamid, flutolanil, furametpyr, metalaxyl, ofurace, oxadixyl, oxycarboxin, penthiopyrad, thifluzamide, tiadinil, 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;
- carboxylic acid morpholides: dimethomorph, flumorph;
- 30 - benzamides: flumetover, fluopicolide (picobenzamid), zoxamide;
- other carboxamides: carpropamid, diclocymet, mandipropamid, 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;

35

Azoles

- triazoles: bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, enilconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, flusilazole, fluquinconazole, flutriafol, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prothioconazole,
- 40

simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimenol, triadimefon, triticonazole;

- imidazoles: cyazofamid, imazalil, pefurazoate, prochloraz, triflumizole;
- benzimidazoles: benomyl, carbendazim, fuberidazole, thiabendazole;
- 5 - others: ethaboxam, etridiazole, hymexazole;

Nitrogenous heterocyclyl compounds

- pyridines: fluazinam, pyrifenox, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine;
- 10 - pyrimidines: bupirimate, cyprodinil, ferimzone, fenarimol, mepanipirim, nuarimol, pyrimethanil;
- piperazines: triforine;
- pyrroles: fludioxonil, fenciclonil;
- morpholines: aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph;
- 15 - dicarboximides: iprodione, procymidone, vinclozolin;
- others: acibenzolar-S-methyl, anilazine, captan, captafol, dazomet, diclomezine, fenoxanil, folpet, fenpropidin, famoxadone, fenamidone, octhilinone, probenazole, proquinazid, pyroquilon, quinoxifen, tricyclazole, 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,N-dimethyl-3-(3-bromo-6-fluoro-2-methylindole-1-sulfonyl)-[1,2,4]triazole-1-sulfonamide;
- 20

Carbamates and dithiocarbamates

- dithiocarbamates: ferbam, mancozeb, maneb, metiram, metam, propineb, thiram,
- 25 zineb, ziram;
- carbamates: diethofencarb, flubenthiavalecarb, iprovalicarb, propamocarb, methyl 3-(4-chlorophenyl)-3-(2-isopropoxycarbonylamino-3-methylbutyrylamino)propionate, 4-fluorophenyl N-(1-(1-(4-cyanophenyl)ethanesulfonyl)but-2-yl)carbamate;

30

Other fungicides

- guanidines: dodine, iminoctadine, guazatine;
- antibiotics: kasugamycin, polyoxins, streptomycin, validamycin A;
- organometal compounds: fentin salts;
- 35 - sulfur-containing heterocyclyl compounds: isoprothiolane, dithianon;
- organophosphorus compounds: edifenphos, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprobenfos, pyrazophos, tolclofos-methyl, phosphorous acid and its salts;
- organochlorine compounds: thiophanate methyl, chlorothalonil, dichlofluanid, tolylfluanid, flusulfamide, phthalide, hexachlorobenzene, pencycuron, quintozone;
- 40 - nitrophenyl derivatives: binapacryl, dinocap, dinobuton;
- inorganic active compounds: Bordeaux mixture, copper acetate, copper hydroxide, copper oxychloride, basic copper sulfate, sulfur;

- other: spiroxamine, cyflufenamid, cymoxanil, metrafenone.

Synthesis examples

- 5 The specifications given in the synthesis examples below were used with appropriate modification of the starting compounds to obtain further compounds I. The compounds thus obtained are listed with physical data in the table which follows.

Example 1: Preparation of 3-cyano-1-methoxyundecanone

10

A suspension of 20.0 g (169 mmol) of potassium tert-butoxide in 120 ml of anhydrous dimethylformamide (DMF) was treated with 12.2 g (80 mmol) of decanitrile and 11.0 g (106 mmol) of methyl methoxyacetate. After 18 hours of stirring at from 20-25°C, the solvent was removed by distillation, and the residue was taken up in water and washed with cyclohexane. The aqueous phase was acidified with conc. hydrochloric acid and extracted with diethyl ether. The combined ether phases were washed with water and dried, and freed from the solvent. The residue was 8.4 g of the title compound in the form of oil, and the compound was preferably reacted without further purification.

- 20 Example 2: Preparation of 7-amino-5-methoxymethyl-6-octyltriazolo(1,5-a)pyrimidine

A solution of 22.0 g of the ketonitrile from Ex. 1, 8.1 g (97 mmol) of 3-amino-1,2,4-triazole, and 3.8 g of p-toluenesulfonic acid in 60 ml of mesitylene were heated for three hours to 180°C, whereupon some solvent was removed by distillation. The solvent was then completely removed by distillation, and the residue was taken up in dichloromethane. After washing with saturated NaHCO₃ solution and water, the organic phase was dried and freed from the solvent, and the residue was digested with diethyl ether. The residue was 15.0 g of the title compound in the form of white crystals of freezing point from 180-181°C.

30

63

Table I -- Compounds of the formula I

No.	R ¹	R ²	R ³	A	Phys. Data (Fp. [°C])
I-1	(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	180-181
I-2	(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N	180-181
I-3	(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₅ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	133-134
I-4	(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	127-128
I-5	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	188-189
I-6	(CH ₂) ₉ CH ₃	(CH ₂) ₃ S(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)	H	N	125-127

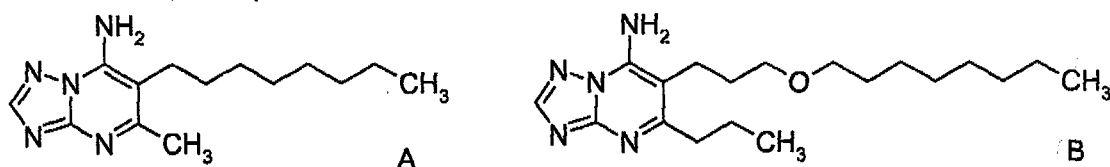
Examples of activity against harmful fungi

5

The fungicidal activity of the compounds of the formula I could be demonstrated via the following experiments:

- 10 The active ingredients were prepared in the form of a stock solution with 25 mg of active ingredient which was made up to 10 ml with a mixture composed of acetone and/or DMSO and of the emulsifier Uniperol® EL (wetting agent with emulsifying and dispersing action based on ethoxylated alkylphenols) in a solvent:emulsifier ratio by volume of 99:1. Water was then used to make up the volume to 100 ml. This stock solution was diluted to the active ingredient concentration stated below with the
- 15 solvent/emulsifier/water mixture described.

Comparative compounds used comprise the known active ingredients A and B from EP-A 141 317, example No. 4 and 42:



20

Usage Example 1 - Activity against late blight on tomatoes by *Phytophthora infestans* on protective treatment

- 25 Leaves of potted tomato plants were sprayed to runoff with an aqueous suspension having the concentration stated below of active ingredient. 1 day and, respectively, 7 days after application, the leaves were infected with an aqueous sporangia suspension of *Phytophthora infestans*. The plants were then placed in a water-vapor-saturated chamber at temperatures of from 18 to 20°C. After six days, the development of the late blight on

64
64

the untreated but infected control plants was so marked that the infestation could be determined visually in %.

5 In the tests using 1 day of protective treatment, the plants treated with 16 ppm of the compound I-1 exhibited 15% infestation, whereas the plants treated with 16 ppm of the comparative compound A had 70%, and the untreated plants had 90% infestation. In these tests, the plants treated with 250 ppm of the compound I-4 exhibited only 1% infestation, whereas the plants treated with 250 ppm of the comparative compound B, and the untreated plants, had 90% infestation.

10

In another type of test using 1 day of protective treatment, the plants treated with 63 ppm of the compounds I-1, I-4, and, respectively, I-5 exhibited at most 5% infestation, whereas the untreated plants had 90% infestation.

15 In another type of test, with 3 days of protective treatment, the plants treated with 250 ppm of the compounds I-1 and, respectively, I-4 exhibited at most 20% infestation, whereas the plants treated with 250 ppm of the comparative compounds A and B, and also the untreated plants, had 90% infestation.

20 In another type of test, with 7 days of protective treatment, the plants treated with 63 ppm of the compound I-1 exhibited at most 5% infestation, whereas the untreated plants had 90% infestation.

25 Usage Example 2 - Long lasting activity against peronospora on grapevines caused by *Plasmopara viticola* on protective treatment

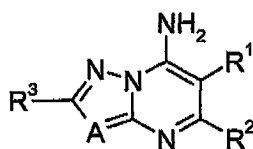
30 Leaves of potted vines were sprayed to runoff with an aqueous suspension having the concentration stated below of active ingredient. 1 and, respectively, 7 days after application, the undersides of the leaves were inoculated with an aqueous sporangia suspension of *Plasmopara viticola*. The vines were then first placed for 48 hours in a water-vapor-saturated chamber at 24°C and were then placed for 5 days in a greenhouse at temperatures of from 20 to 30°C. After this time, the plants were again placed in a moist chamber for 16 hours to accelerate sporangiophore eruption. The extent of development of infestation on the undersides of the leaves was then
35 determined visually.

40 In the tests with 1 day of protective treatment, the plants treated with 63 ppm of the compounds I-1, I-4 and, respectively, I-5 exhibited at most 3% infestation, whereas the untreated plants had 90% infestation.

66
66

Patent claims

1. A 5-alkoxyalkyl-6-alkyl-7-aminoazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are defined as follows:

R^1 is C_1 - C_{12} -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -alkoxyalkyl, C_2 - C_{12} -cyanoalkyl, and C_8 - C_{19} -benzyloxyalkyl, where the groups in the aliphatic or aromatic moiety may be unsubstituted or may have substitution by from one to three groups R^a :

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxy, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkylthio, and $NR^A R^B$;
 R^A, R^B are hydrogen and C_1 - C_6 -alkyl;

R^2 is C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, phenoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -alkylthio- C_1 - C_{12} -alkyl, and phenylthio- C_1 - C_{12} -alkyl, in which groups the carbon chains can have substitution by from one to three groups R^a , and the phenyl rings can have substitution by from one to five substituents composed of C_1 - C_6 -alkyl or of a group R^a ;

R^3 is hydrogen and C_1 - C_6 -alkyl;

A is N and C- R^A .

2. The compound of the formula I according to claim 1, in which

R^2 is C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl and C_1 - C_{12} -alkylthio- C_1 - C_{12} -alkyl, in which groups the carbon chains may be unsubstituted or may have substitution by from one to three groups R^a .

3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2, in which the substituents are defined as follows:

R^1 is C_1 - C_{12} -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_2 - C_{12} -alkenyl, C_2 - C_{12} -alkynyl, C_2 - C_{12} -alkoxyalkyl, C_2 - C_{12} -cyanoalkyl, C_1 - C_{12} -haloalkyl, C_1 - C_{12} -hydroxyalkyl, and C_8 - C_{19} -benzyloxyalkyl; and

R^2 is C_1 - C_{12} -alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl.

67
67

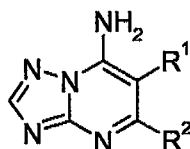
4. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 3, where R¹ is an unsubstituted unbranched or singly, doubly, or triply branched C₁-C₁₂-alkyl chain, C₂-C₁₂-cyanoalkyl chain, C₁-C₁₂-haloalkyl chain, or C₁-C₁₂-hydroxyalkyl chain.

5

5. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 4, where R² is C₁-C₁₂-alkoxymethyl.

10

6. The compound of the formula I according to claim 1, which corresponds to the formula I.A

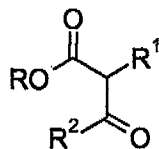


I.A

in which the variables are defined according to any of claims 1 to 4.

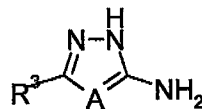
15

7. A process for preparation of compounds of the formula I according to any of claims 1 to 5, which comprises reacting β-ketoesters of the formula II,



II

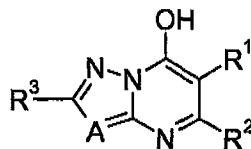
in which R is C₁-C₄-alkyl, with 3-amino-1,2,4-triazole or -pyrazole of the formula III



III

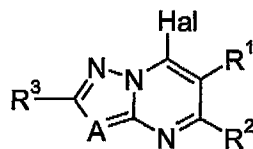
20

to give 7-hydroxyazolopyrimidines of the formula IV



IV

which are halogenated to give compounds of the formula V,



V

where Hal is chlorine or bromine, and reacting V with ammonia.

25

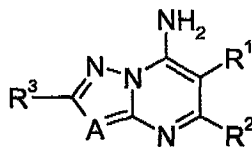
8. The compound of the formula IV and the compound of the formula V according to claim 7.

5-Alkoxyalkyl-6-alkyl-7-aminoazolopyrimidines, process for their preparation, their use for controlling harmful fungi, and compositions comprising them

Abstract

5

5-Alkoxyalkyl-6-alkyl-7-aminoazolopyrimidines of the formula I



in which the substituents are defined as follows:

- 10 R¹ is alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxyalkyl, cyanoalkyl, and benzyloxyalkyl, where the groups in the aliphatic or aromatic moiety may be unsubstituted or may have substitution by from one to three groups R^a:

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxy, cycloalkyl, alkoxy, alkylthio, and NR^AR^B;

15

R^A, R^B are hydrogen and alkyl;

R² is alkoxyalkyl, phenoxyalkyl, alkylthioalkyl, and phenylthioalkyl, which groups may have no substitution or may have substitution according to the description;

20

R³ is hydrogen and alkyl;

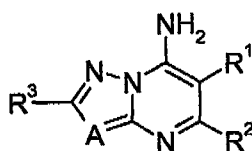
A is N and C-R^A;

- 25 processes for preparation of these compounds, compositions comprising them, and their use for controlling phytopathogenic harmful fungi.

5-Alcoxialquil-6-alkuil-7-amino-azolopirimidinas, un procedimiento para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

5 Descripción

La presente invención se refiere a 5-alcoxialquil-6-alkuil-7-amino-azolopirimidinas de la fórmula I



10 en la que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es C₁-C₁₂-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₁₂-alquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, C₂-C₁₂-alcoxialquilo, C₂-C₁₂-cianoalquilo y C₈-C₁₉-benciloxialquilo, pudiendo los grupos en la parte alifática o aromática ser no sustituidos o estar sustituidos por uno a tres grupos R^a:

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquiltio y NR^AR^B;

R^A, R^B significan hidrógeno y C₁-C₆-alquilo;

20

R² es C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, fenoxi-C₁-C₁₂-alquilo, C₁-C₁₂-alquiltio-C₁-C₁₂-alquilo y feniltio-C₁-C₁₂-alquilo, en cuyos grupos las cadenas de carbono pueden

71

estar sustituidas por uno a tres grupos R^a y los anillos fenilo pueden estar sustituidos por uno a cinco sustituyentes C_1-C_6 -alquilo o un grupo R^a ;

R^3 es hidrógeno y C_1-C_6 -alquilo;

5

A es N y $C-R^A$.

Además, la invención se refiere a un procedimiento para la preparación de estos compuestos, a productos que los contienen, así como al uso de los mismos para
10 combatir hongos nocivos.

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

Por tanto, se encontraron los compuestos definidos al comienzo. Además, se encontraron un procedimiento y productos intermedios para su obtención, productos
20 que contienen los mismos, así como un procedimiento para combatir hongos nocivos usando los compuestos I.

Los compuestos de la fórmula I se distinguen de los compuestos indicados en las publicaciones arriba indicadas por una configuración especial del sustituyente en la
25 posición 5 del esqueleto de triazolopirimidina.

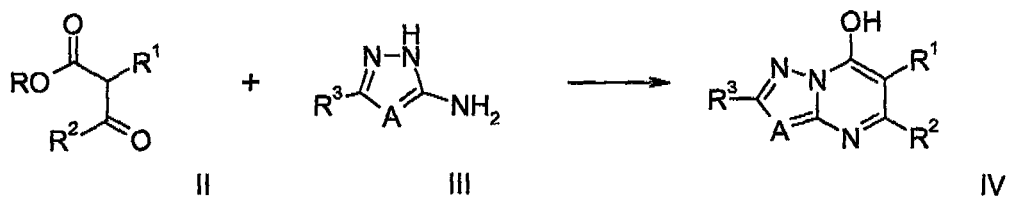
72
72

Los compuestos de la fórmula I presentan, en comparación con los compuestos conocidos, una más alta eficiencia contra hongos nocivos.

Los compuestos según la invención se pueden obtener mediante diferentes métodos.

- 5 Ventajosamente, se obtienen por reacción de β -ceto ésteres sustituidos de la fórmula II con 3-amino-1,2,4-triazol o -pirazol de la fórmula III dando 7-hidroxiazolopirimidinas de la fórmula IV. Los grupos R^1 y R^2 en las fórmulas II y IV tienen los significados indicados para la fórmula I y el grupo R en la fórmula II significa C_1 - C_4 -alquilo, por razones prácticas se prefiere metilo, etilo o propilo.

10

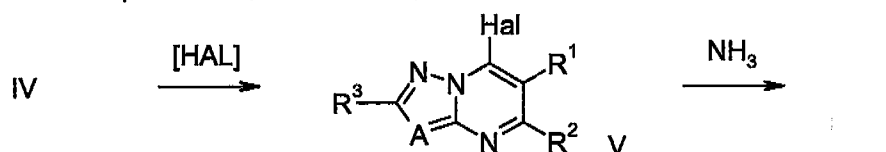


- La transformación de los β -ceto ésteres de la fórmula II con los aminoazoles de la fórmula III puede efectuarse en presencia o ausencia de disolventes. Es ventajoso usar aquellos disolventes, que son substancialmente inertes frente a los insumos y en
- 15 los cuales estos están parcialmente o completamente solubles. Como disolventes son apropiados, especialmente, alcoholes, tales como etanol, propanoles, butanoles, glicoles o monoéter glicólico, dietilenglicoles o sus monoéteres, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, benceno o mesitileno, amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamida, dibutilformamida, N,N-dimetilacetamida, ácidos
- 20 alcanóicos inferiores, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o bases, tales como hidróxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, óxidos de metal alcalino y alcalinotérreo, hidruros de metal alcalino y alcalinotérreo, amidas de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, así como hidrogenarbonatos

de metal alcalino, compuestos de metal orgánicos, especialmente, alquilos de metal alcalino, haluros de alquilmagnesio, así como alcoholatos de metal alcalino y alcalinotérreo y dimetoximagnesio, además, bases orgánicas, p.ej. aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tri-isopropilamina, tributilamina y N-
5 metilpiperidina, N-metilmorfolina, piridina, piridinas sustituidas, tales como collidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, así como aminas bicíclicas y mezclas de estos disolventes con agua. Como catalizadores son apropiados las bases, como las arriba mencionadas o ácidos, tales como ácidos sulfónico o ácidos minerales. Muy preferentemente se realiza la reacción sin disolvente o en clorobenceno, xileno,
10 sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona. Bases especialmente preferidas son las aminas terciarias, tales como tri-isopropilamina, tributilamina, N-metilmorfolina o N-metilpiperidina. Las temperaturas se encuentran entre 50 y 300°C, preferentemente ascienden a 50 a 180°C, cuando se trabaja en solución [ver EP-A 770 615; Adv. Het. Chem. Vol. 57, pp. 81 y sig. (1993)].

15

Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también se pueden usar en cantidades equimolares, en exceso o, en caso dado, como disolventes.



Los condensados así obtenidos de la fórmula IV se precipitan de las soluciones de
20 reacción, generalmente, en forma pura y después de lavarlas con el mismo disolvente o con agua y secarlas, se transforman con agentes de halogenación, especialmente, agentes de cloración o bromación en los compuestos de la fórmula V, donde Hal significa cloro o bromo, especialmente, cloro. Preferentemente, se realiza la reacción

24
71

en agentes de cloración, tales como oxícloruro fosfórico, cloruro de tionilo o cloruro de sulfurilo a 50°C hasta 150°C, preferentemente, en oxitricloruro fosfórico excesivo a temperatura de reflujo. Después de evaporarse el oxitricloruro fosfórico excesivo se trata el residuo con agua helada, opcionalmente, bajo adición de un disolvente no miscible con agua. El producto de cloración aislado de la fase orgánica secada, opcionalmente, tras evaporación del disolvente inerte, es, generalmente, muy puro y es transformado, luego, con amoníaco en un disolvente inerte a 100°C hasta 200°C en las 7-amino-azolo[1,5-a]-pirimidinas. La reacción se lleva a cabo, preferentemente, con un exceso 1 hasta 10 veces molar de amoníaco a una presión de 1 a 100 bar.

10

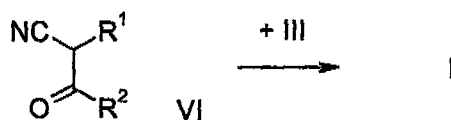
Las nuevas 7-amino-azolo[1,5-a]-pirimidinas son aisladas, opcionalmente tras evaporación del disolvente, por digestión en agua en forma de compuestos cristalinos.

Los β-ceto ésteres de la fórmula II pueden ser preparados en la forma indicada en

15 Organic Synthesis Coll. Vol. 1, p. 248, o bien se obtienen en el comercio.

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

20



La reacción puede ser realizada en presencia o ausencia de disolventes.

Ventajosamente, se usan aquellos disolventes, que son substancialmente inertes frente a los insumos y en los cuales éstos son parcial o completamente solubles.

Como disolventes son apropiados, especialmente, alcoholes, tales como etanol,

75
25

propanoles, butanoles, glicoles o monoéter glicólico, dietilenglicoles o sus monoéteres, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, benceno o mesitileno, amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamida, dibutilformamida, N,N-dimetilacetamida, ácidos alcanoicos inferiores, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o bases, tales como las arriba mencionadas, y mezclas de estos disolventes con agua. Las temperaturas de reacción varían entre 50 y 300°C, preferentemente de 50 a 150°C, cuando se trabaja en solución.

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

Los alquilcianuros de la fórmula VI necesarios para la preparación de las 7-amino-azolo[1,5-a]-pirimidinas son en parte conocidos o pueden ser preparados según métodos conocidos a partir de alquilcianuros y ésteres de ácido carboxílico con bases fuertes, tales como hidruros alcalinos, alcoholatos de metal alcalino o alquilenos de metal [ver: J. Amer. Chem. Soc. Vol. 73, (1951) p. 3766].

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

Si en la síntesis se obtienen mezclas isómeras, generalmente, no es necesario separarlas, ya que los diferentes isómeros pueden convertirse, en parte, durante la preparación para la aplicación o en la aplicación (p.ej. bajo la acción de la luz o de ácidos o bases) el uno en el otro. Transformaciones correspondientes pueden tener

76

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
5 términos colectivos representativos de los sustituyentes siguientes:

halógeno: flúor, cloro, bromo e yodo;

alquilo: radicales hidrocarburo lineales o uno o dos veces ramificados con 1 a 4, ó 5 a
10 12 átomos de carbono, p.ej. C₁-C₆-alquilo, tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

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

cicloalquilo: grupos hidrocarburos mono o bicíclicos saturados con 3 a 6 miembros anulares de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

77
77

alcoxialquilo: cadena de hidrocarburo saturada, lineal o dos o tres veces ramificada, que está interrumpida por un átomo de oxígeno, p.ej. C₅-C₁₂-alcoxialquilo: cadena de hidrocarburo, como la arriba descrita con 5 a 12 átomos de carbono, que puede estar interrumpida por un átomo de oxígeno en una posición arbitraria, como p.ej. propoxi-
5 etilo, butoxi-etilo, pentoxi-etilo, hexiloxi-etilo, heptiloxi-etilo, octiloxi-etilo, noniloxi-etilo, 3-(3-etil-hexiloxi)-etilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-etilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-etilo, etoxi-propilo, propoxi-propilo, butoxi-propilo, pentoxi-propilo, hexiloxi-propilo, heptiloxi-propilo, octiloxi-propilo, noniloxi-propilo, 3-(3-etil-hexiloxi)-propilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-propilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-propilo, etoxi-butilo, propoxi-butilo, butoxi-
10 butilo, pentoxi-butilo, hexiloxi-butilo, heptiloxi-butilo, octiloxi-butilo, noniloxi-butilo, 3-(3-etil-hexiloxi)-butilo, 3-(2,4,4-trimetil-pentiloxi)-butilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-butilo, metoxi-pentilo, etoxi-pentilo, propoxi-pentilo, butoxi-pentilo, pentoxi-pentilo, hexiloxi-pentilo, heptiloxi-pentilo, 3-(3-metil-hexiloxi)-pentilo, 3-(2,4-dimetil-pentiloxi)-pentilo, 3-(1-etil-3-metil-butoxi)-pentilo;

15

En el ámbito de la invención están incluidos los isómeros (R) y (S) y los racematos de compuestos de la fórmula I, que presentan centros de quiralidad.

Con respecto al uso a que están destinadas las azolopirimidinas de la fórmula I son
20 especialmente preferidos los siguientes significados de los sustituyentes, tanto por si solos como también en combinaciones:

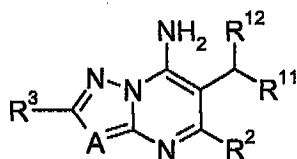
Se prefieren compuestos I, en los que el grupo R¹ tiene, como máximo, 12 átomos de carbono.

25

78
98

Los grupos alquilo en R¹ en la fórmula I representan, preferentemente, un grupo alquilo con 1 a 12 átomos de carbono no ramificado, uno, dos, tres o más veces ramificado, especialmente, no ramificado.

- 5 Además, se prefieren compuestos de la fórmula I, que en R¹ en el átomo α-carbono presentan una ramificación. Pueden ser representados por la fórmula Ia:



Ia

- en la que R¹¹ significa C₃-C₁₀-alquilo o C₅-C₁₀-alcoxialquilo y R¹² significa C₁-C₄-alquilo, especialmente, metilo, siendo preciso, que R¹¹ y R¹² tengan juntos, como máximo, 12 átomos de carbono y que sean no sustituidos, o puedan estar sustituidos como R¹ en la fórmula I, y las otras variables tienen las definiciones indicadas para la fórmula I.
- 10

Si R¹ representa un grupo alquilo sustituido por ciano, entonces se encuentra el grupo ciano, preferentemente, en el átomo de carbono terminal.

15

Si R¹ representa un grupo alquilo sustituido por halógeno, entonces la halogenación se encuentra en el átomo α- o Ω-carbono.

En otra forma de realización representa t R¹ un grupo alquilo sustituido por hidroxilo.

20

Son preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa un grupo alquilo de 5 a 12 átomos de carbono no ramificado, uno, dos, tres o más veces ramificado o un grupo C₅-C₁₀-alcoxipropilo sin sustitución adicional.

79
79

Son especialmente preferidos los compuestos I, en los que R¹ significa n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, n-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 ó 1-etil-2-metilpropilo.

Además, son preferidos los compuestos de la fórmula I, en los que R¹ significa n-heptilo, 1-metilhexilo, n-octilo, 1-metilheptilo, n-nonilo, 1-metiloctilo, 3,5,5-trimetilhexilo, n-decilo, 1-metilnonilo, n-undecilo, 1-metildecilo, n-dodecilo y 1-metilundecilo.

En otra modalidad de los compuestos I según la invención R¹ representa metoxi-n-propilo, etoxi-n-propilo, n-propoxi-n-propilo, n-butoxi-n-propilo, n-pentiloxi-n-propilo, n-hexiloxipropilo, n-heptiloxi-n-propilo, n-octiloxi-n-propilo, n-noniloxi-n-propilo o n-deciloxi-n-propilo.

En una modalidad preferida de los compuestos I según la invención R² significa C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo, especialmente, C₁-C₁₂-alcoximetilo.

En otra modalidad preferida, R² significa metoxi-C₁-C₁₂-alquilo, especialmente, metoximetilo.

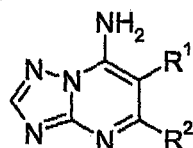
En una modalidad preferida de los compuestos I según la invención A representa un átomo de oxígeno.

80
80

En otra modalidad de los compuestos I, A representa CR⁴, especialmente, CH.

Además, son preferidos los compuestos I, en los que R³ significa hidrógeno.

- 5 Una modalidad especialmente preferida de los compuestos según la invención de la fórmula I se refiere a aquellos de la fórmula I.A:



I.A

en la que R¹ y R² tienen las definiciones indicadas para la fórmula I, representando R¹, especialmente, C₁-C₁₂-alquilo y R², especialmente, C₁-C₁₂-alcoximetilo,

- 10 preferentemente metoximetilo.

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

- 15 mencionados, una variante especialmente preferida del correspondiente sustituyente.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R¹ equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R² significa metoximetilo

20

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R¹ equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R² significa etoximetilo

81

Tabla 3

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 significa n-propoximetilo

5 Tabla 4

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 significa metoxietilo

Tabla 5

10 Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 significa etoxietilo

Tabla 6

15 Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 significa n-propoxietilo.

Tabla 7

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 significa 3-metoxi-n-propilo

20

Tabla 8

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 significa 3-etoxi-n-propilo

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A y R^2 3- significa n-propoxi-n-propilo

5 Tabla 10

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa metoximetilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

10 Tabla 11

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa etoximetilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

15 Tabla 12

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa n-propoximetilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

20 Tabla 13

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa metoxietilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

83
83

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa etoxietilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

5

Tabla 15

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa n-propoxietilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH.

10

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa 3-metoxi-n-propilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

15

Tabla 17

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa 3-etoxi-n-propilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

20

Tabla 18

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa 3-n-propoxi-n-propilo, R^3 significa hidrógeno y A significa CH

25

84
84

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa metoximetilo, R^3 significa CH_3 y A significa CH

5

Tabla 20

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa etoximetilo, R^3 significa CH_3 y A significa CH

10

Tabla 21

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa n-propoximetilo, R^3 significa CH_3 y A significa CH

15

Tabla 22

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa metoxietilo, R^3 significa CH_3 y A significa CH

20

Tabla 23

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R^1 equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R^2 significa etoxietilo, R^3 significa CH_3 y A significa CH

25

85

Tabla 24

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R¹ equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R² significa n-propoxietilo, R³ significa CH₃ y A significa CH.

5

Tabla 25

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R¹ equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R² significa 3-metoxi-n-propilo, R³ significa CH₃ y A significa CH

10

Tabla 26

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R¹ equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R² significa 3-etoxi-n-propilo, R³ significa CH₃ y A significa CH

15

Tabla 27

Compuestos de la fórmula I.A, en los cuales R¹ equivale a un compuesto de una línea, respectivamente, de la Tabla A, R² significa 3-n-propoxi-n-propilo, R³ significa CH₃ y A significa CH

20

Tabla A

No.	R ¹
A-1	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-2	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-3	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₃

86
86

No.	R ¹
A-5	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-6	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-7	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-8	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-9	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-10	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-11	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-12	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-13	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2$
A-14	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-15	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-16	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-17	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-18	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-19	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-20	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-21	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-22	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-23	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-24	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-25	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-26	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-27	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-28	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-29	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-30	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-31	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-32	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-33	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-34	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

87
87

No.	R ¹
A-35	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-36	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-37	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-38	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-39	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-40	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-41	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-42	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-43	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-44	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-45	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-46	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-47	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-48	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-49	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-50	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-51	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-52	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-53	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-54	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-55	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-56	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-57	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-58	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-59	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-60	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-61	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-62	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_3$
A-63	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-64	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$

No.	R ¹
A-95	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-96	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-97	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-98	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-99	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-100	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-101	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-102	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-103	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-104	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-105	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-106	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-107	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-108	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-109	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-110	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂
A-111	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-112	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-113	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-114	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-115	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-116	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-117	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-118	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-119	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-120	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-121	CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-122	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-123	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-124	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃

92
92

No.	R ¹
A-185	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-186	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-187	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-188	ciclopropilo
A-189	ciclopentilo
A-190	ciclohexilo
A-191	CH=CH_2
A-192	$\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$
A-193	CH=CHCH_3
A-194	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$
A-195	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$
A-196	$\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_3$
A-197	$\text{CH=CHCH}_2\text{CH}_3$
A-198	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH=CH}_2$
A-199	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-200	$\text{CH=C}(\text{CH}_3)_2$
A-201	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$
A-202	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_3$
A-203	$\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_2\text{CH}_3$
A-204	$\text{CH=CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-205	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$
A-206	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$
A-207	$\text{CH}_2\text{CH=C}(\text{CH}_3)_2$
A-208	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$
A-209	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_3$
A-210	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_2\text{CH}_3$
A-211	$\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-212	$\text{CH=CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-213	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$
A-214	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_3$

93

No.	R ¹
A-215	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-216	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-217	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-218	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-219	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-220	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-221	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-222	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-223	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-224	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-225	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-226	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-227	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-228	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-229	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-230	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-231	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-232	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-233	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-234	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-235	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-236	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-237	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-238	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-239	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-240	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-241	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-242	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-243	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-244	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

84
94

No.	R ¹
A-245	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-246	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-247	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-248	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-249	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-250	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-251	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-252	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$
A-253	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-254	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-255	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-256	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-257	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-258	$\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-259	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-260	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$
A-261	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-262	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-263	$\text{C}\equiv\text{CH}$
A-264	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-265	$\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-266	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-267	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-268	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-269	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}\equiv\text{CH}$
A-270	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-271	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-272	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-273	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-274	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$

95

No.	R ¹
A-275	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-276	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-277	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-278	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-279	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-280	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-281	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-282	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-283	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-284	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-285	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-286	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-287	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-288	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-289	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-290	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-291	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-292	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-293	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-294	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-295	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-296	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-297	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-298	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-299	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-300	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-301	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-302	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-303	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-304	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

96

No.	R ¹
A-305	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-306	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-307	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-308	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-309	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-310	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-311	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-312	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$
A-313	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-314	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-315	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-316	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-317	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-318	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-319	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
A-320	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
A-321	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-322	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-323	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-324	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-325	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-326	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-327	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-328	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-329	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$

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

5 *basidiomicetos*, especialmente, de la clase de los *oomicetos*. En parte son

97
97

sistémicamente activos y pueden ser usados en la protección de plantas como desinfectantes, fungicidas foliares y del suelo.

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

Son especialmente apropiados para combatir las siguientes enfermedades en plantas:

- 10
 - especies de *Alternaria* en legumbres, colza, remolachas azucareras y frutas y arroz,
 - especies de *Aphanomyces* en remolachas azucareras y legumbres,
 - especies de *Bipolaris* y *Drechslera* en maíz, cereales, arroz y césped,
 - *Blumeria graminis* (oídio) en cereales,
- 15
 - *Botrytis cinerea* (moho gris) en fresas, legumbres, flores y vid,
 - *Bremia lactucae* en lechuga,
 - especies de *Cercospora* en maíz, soja, arroz y remolachas,
 - especies de *Cochliobolus* en maíz, cereales, arroz (p.ej. *Cochliobolus sativus* en cereales, *Cochliobolus miyabeanus* en arroz),
- 20
 - especies de *Colletotricum* en soja, algodón,
 - especies de *Drechslera* en cereales y maíz,
 - especies de *Exserohilum* en maíz,
 - *Erysiphe cichoracearum* y *Sphaerotheca fuliginea* en pepinos,
 - especies de *Fusarium* y *Verticillium* en diferentes plantas,
- 25
 - *Gaeumanomyces graminis* en cereales,

98

- especies de *Gibberella* en cereales y arroz (p.ej. *Gibberella fujikuroi* en arroz),
- *Grainstaining complex* en arroz,
- especies de *Helminthosporium* en maíz y arroz,
- *Microdochium nivale* en cereales,
- 5 - especies de *Mycosphaerella* en cereales, plátanos y maní,
- *Phakopsara pachyrhizi* y *Phakopsara meibomia* en soja,
- especies de *Phomopsis* en soja y girasoles ,
- *Phytophthora infestans* en papas y tomates
- *Plasmopara viticola* en vid,
- 10 - *Podosphaera leucotricha* en manzanas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* en cereales,
- especies de *Pseudoperonospora* en lúpulo y pepinos,
- especies de *Puccinia* en cereales y maíz,
- especies de *Pyrenophora* en cereales,
- 15 - especies de *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*,
S.attenuatum, *Entiloma oryzae* en arroz,
- *Pyricularia grisea* en césped y cereales,
- *Pythium spp.* en césped, arroz, maíz, algodón, colza, girasoles, remolachas
azucarenas, legumbres y otras plantas,
- 20 - especies de *Rhizoctonia* en algodón, arroz, papas, césped, maíz, colza, papas,
remolachas azucarenas, legumbres y otras plantas,
- especies de *Sclerotinia* en colza y girasoles,
- *Septoria tritici* y *Stagonospora nodorum* en trigo,
- *Erysiphe* (syn. *Uncinulanecator*) en vid,
- 25 - especies de *Setosphaeria* en maíz y césped,

99
99

- *Sphacelotheca reilinia* en maíz,
 - especies de *Thievaliopsis* en soja y algodón,
 - especies de *Tilletia* en cereales,
 - especies de *Ustilago* Arten en cereales, maíz y remolacha azucarera y
- 5 - especies de *Venturia* Arten (roña) en manzanas y peras.

Son especialmente apropiados para combatir los hongos nocivos de la clase de los oomicetos, tales como especies de *Peronospora*, especies de *Phytophthora*, *Plasmopara viticola* y especies de *Pseudoperonospora*.

10

Los compuestos I son apropiados, además, para combatir hongos nocivos en la protección de materiales (p.ej. madera, papel, dispersiones de pinturas, fibras o bien tejidos) y en la protección de existencias. En la protección de madera son importantes, especialmente, los siguientes hongos nocivos: ascomicetos, tales como *Ophiostoma*

- 15 spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma* spp., *Chaetomium* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *trichurus* spp.; basidiomicetos, tales como *Coniophora* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophillum* spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. y *Tyromyces* spp., deuteromicetos, tales como *Aspergillus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicillium* spp., *Trichoderma* spp., *Alternaria* spp., *Paecilomyces*
- 20 spp. y zigomicetos, tales como *Mucor* spp., además, en la protección de materiales los siguientes sacaromicetos: *Candida* spp. y *Saccharomyces cerevisiae*.

Los compuestos I se usan, tratando las plantas, semillas, materiales o el suelo a proteger frente a la infestación por los hongos, con una cantidad efectiva fungicida de

100
100

los principios activos. La aplicación se puede efectuar tanto antes como también después de la infección de los materiales, plantas o semillas por los hongos.

Los productos fungicidas contienen, generalmente, entre 0,1 y 95, preferentemente, entre 0,5 y 90 % en peso principio activo.

Las cantidades de aplicación varían en la fitosanidad, dependiendo del tipo de efecto deseado, entre 0,01 y 2,0 kg principio activo por ha.

10 En el tratamiento de semillas, p.ej. por empolvado, recubrimiento o impregnación de las semillas, se suelen aplicar cantidades de principio activo de 1 a 1000 g/100 kg, preferentemente, 5 a 100 g/100 kg de semillas.

En la aplicación en la protección de materiales o existencias depende la cantidad de aplicación en principio activo del tipo del campo de aplicación y del efecto deseado. CANTIDADES DE APLICACIÓN USUALES EN LA PROTECCIÓN DE MATERIALES VARÍA, POR EJEMPLO, DE 0,001 g a 2 kg, preferentemente, 0,005 g a 1 kg de principio activo por metro cúbico del material tratado.

20 Los compuestos de la fórmula I pueden estar presentes en diferentes modificaciones cristalinas, que pueden distinguirse en su eficiencia biológica. Estas modificaciones también son objeto de la presente invención.

Los compuestos I pueden ser transformados en las formulaciones usuales, p.ej. soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. Las formas de

10/10/11

aplicación dependen del respectivo fin de aplicación; en todo caso debe estar asegurada una distribución lo más fina posible del compuesto según la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, diluyendo el principio activo con disolventes y/o soportes, en caso de deseárselo, 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, gamma-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grados y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,
- sustancias soporte, tales como polvos de piedras naturales (p.ej. caolines, arcillas, talco, tiza) y polvos de piedra sintéticos (p.ej. ácido silícico altamente disperso, silicatos); emulsionantes, tales como emulsionantes no ionógenos y aniónicos (p.ej. éteres de polioxietileno-alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo) y dispersantes, tales como lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.

20

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

25

102
102

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

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

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

20

Los granulados (p.ej. granulados recubiertos, impregnados o homogéneos) se pueden preparar uniend o el principio 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,

25

103
103

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.

- 5 Las formulaciones contienen, generalmente, entre 0,01 y 95 % en peso, preferentemente, entre 0,1 y 90 % en peso del principio activos. Los principios activos suelen ser usados en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, 95% a 100% (según espectro NMR).

- 10 Ejemplos de formulaciones según la invención son:

1. Productos para la dilución en agua

- 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.

- 20 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

104
104**C Concentrados emulsionables (EC)**

15 partes en peso de un compuesto según la invención se disuelven en 75 partes en peso de xileno adicionando dodecibencenosulfonato 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 dodecibencenosulfonato 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.

15 E Suspensiones (SC, OD, FS)

20 partes en peso de un compuesto según la invención se desmenuzan 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 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)

50 partes en peso de un compuesto según la invención se muelen finamente tras adición de 50 partes en peso de dispersante y humectante y se transforman,

105
105

valiéndose de aparatos técnicos (extrusionadora, 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 contiene 50 % en peso de ingrediente activo.

5

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 asciende a 75 % en peso.

10

H Formulaciones de gel

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.

15

2. Productos para la aplicación directa

20 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.

106

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

5 granulado para la aplicación directa con 0,5 % en peso de ingrediente activo.

K Soluciones de volumen ultabajo (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

10 producto para la aplicación directa con 10 % en peso de ingrediente activo.

Para el tratamiento de semillas se suelen usar concentrados solubles en agua (LS), suspensiones (FS), polvos (DS), polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WS, SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y formulaciones

15 de gel (GF). Estas formulaciones se pueden aplicar sobre las semillas en forma diluida o no diluida, preferentemente se aplican en forma diluida. La aplicación se puede realizar antes de la siembra.

Los principios activos pueden ser usados como tales, en forma de sus formulaciones o

20 las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas, por ejemplo, como soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite directamente pulverizables, pastas, polvos pulverizables, agente de rociado o de regado. Las formas de aplicación dependen enteramente del fin de aplicación, pero en todo caso hay que asegurar una distribución lo más fina posible del los principios

25 activos según la invención.

107
67

Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables, dispersiones de aceite) adicionando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite se

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

10

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, entre 0,01 y 1%.

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

A los principios activos se pueden adicionar varios tipos de aceite, humectantes,

20 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 1:100 hasta 100:1, preferentemente, de 1:10 hasta 10:1.

108
108

- Como adyuvantes en este sentido son apropiados, especialmente: polisiloxanos orgánicamente modificados, por ejemplo, Break Thru S 240®; alcoxiatos de alcohol, por ejemplo, Atplus 245®, Atplus MBA 1303®, Plurafac LF 300® und Lutensol ON 30®; polimerizados de bloques de óxido de etileno-óxido de propileno, por ejemplo, Pluronic
- 5 RPE 2035® y Genapol B®; etoxilatos de alcohol, por ejemplo, Lutensol XP 80®; y dioctilsulfosuccinato de sodio, por ejemplo, Leophen RA®.

- Los agentes según la invención en la forma de aplicación como fungicidas pueden estar presentes también en combinación con otros principios activos, p.ej. con
- 10 herbicidas, insecticidas, reguladores del crecimiento, como p.ej. prohexadiona-Ca, fungicidas o también con fertilizantes. Cuando se mezclan los compuestos l o bien los productos que los contienen con uno o varios otros principios activos, especialmente, fungicidas, se alcanza en muchos casos aumentar el espectro de acción o prevenir el desarrollo de resistencias. En numerosos casos se obtienen aquí efectos sinérgicos.
- 15 La siguiente lista de fungicidas, con los cuales se pueden usar los compuestos según la invención es ilustrativa de las posibilidades de combinación, pero no debe entenderse como limitativa:

20 Estrobilurinas

- azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, orisastrobina, (2-cloro-5-[1-(3-metil-benciloxilimino)-etil]-bencil)-carbamato de metilo, (2-cloro-5-[1-(6-metil-piridin-2-ilmetoxilimino)-etil]-bencil)-carbaminato de etilo, 2-(orto-(2,5-dimetilfenil-oximetil)fenil)-3-metoxi-acrilato de metilo;
- 25

109
109

Carboxamidas

- anilidas de ácido carboxílico: benalaxilo, benodanilo, boscalida, carboxina, mepronilo, fenfuram, fenhexamida, flutolanilo, furametpir, metalaxilo, ofurace, oxadixilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida, tiadinilo, (4'-bromobifenil-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-bifenilo-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-carboxílico, (3',4'-dicloro-4-fluoro-bifenilo-2-il)-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-pirazol-4-carboxílico, (2-ciano-fenil)-amida de ácido 3,4-dicloro-isotiazol-5-carboxílico;
- 10 - morfolidas de ácido carboxílico: dimetomorf, flumorf;
- amidas de ácido benzoico: flumetover, fluopicolida (picobenzamida), zoxamida;
- otras amidas de ácido carboxílico: carpropamida, diclocimet, mandipropamida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenilo)-etil)-2-metansulfonilamino-3-metil-butiramida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenil)-etil)-2-etanosulfonilamino-3-metil-butiramida;
- 15

Azoles

- triazoles: bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, fluquinconazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimenol, triadimefona, triticonazol;
- 20
- imidazoles: ciazofamida, ilmazalilo, pefurazoato, procloroaz, triflumizol;
- benzimidazoles: benomilo, carbendazima, fuberidazol, tiabendazol;
- 25 - otros: etaboxam, etridiazol, himexazol;

110
110

Compuestos de heterociclilo conteniendo nitrógeno

- piridinas: fluacinam, pirifenox, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina;
- pirimidinas: bupirinato, ciprodinilo, ferimzona, fenarimol, mepanipirim, nuarimol, 5 pirimetanilo;
- piperacinas: triforina;
- pirroles: fludioxonilo, fenciclonilo;
- morfollnas: aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf;
- dicarboximidas: iprodiona, procimidona, vnclozolina;
- 10 - otros: acibencenoar-S-metilo, anilacina, captano, captafol, dazomet, diclomecina fenoxanilo, folpet, fenpropidina, famoxadone, fenamidona, octilinona, probenazol, proquinazida, piroquilona, quinoxifeno, triciclazol, 5-cloro-7-(4-metil-piperidín-1-il)-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-cromen-4-ona, dimetilamida de ácido 3-(3-bromo-6-fluoro-2-metil-indol-1-sulfonil)-
- 15 [1,2,4]triazol-1-sulfónico;

Carbamatos y ditiocarbamatos

- ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metiram, metam, propineb, tiram, zineb, ziram;
- 20 - carbamatos: dietofencarb, flubentiavalicarb, iprovalicarb, propamocarb, 3-(4-cloro-fenilo)-3-(2-isopropoxycarbonilamino-3-metil-butililamino)-propionato de metilo, N-(1-(1-(4-cianofenilo)etanosulfonil)-but-2-il) carbaminato de (4-fluorofenilo);

Otros fungicidas

- 25 - guanidinas: dodina, iminoctadina, guazatina;

111
111

- antibióticos: kasugamicina, polioxina, estreptomicina, validamicina A;
- compuestos de metal orgánicos: sales de fentina;
- compuestos de heterociclilo conteniendo azufre: isoprotiolana, ditionona;
- compuestos de fósforo orgánicos: edifenfos, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprobenfos,
- 5 pirazofos, tolclufos-metilo, ácido fosforoso y sus sales;
- compuestos de cloro orgánicos: tiofanato metilo, clorotalonilo, diclofluanida, tolilfluanida, flusulfamida, ftalida, hexaclorobenceno, pencicurona, quintoceno;
- derivados de nitrofenilo: binapacril, dinocap, dinobutona;
- principios activos inorgánicos: caldo de Burdeos, acetato de cobre, hidróxido de
- 10 cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;
- otros: espiroxamina, ciflufenamida, cimoxanilo, metrafenona.

Ejemplos de síntesis

- 15 Las prescripciones indicadas en las siguientes ejemplos de síntesis se usan, variando en forma correspondiente los compuestos de partida, para la obtención de otros compuestos. Los compuestos así obtenidos se indican en la siguientes Tabla con sus datos físicos.

- 20 Ejemplo 1: Preparación de 3-ciano-1-metoxiundecanona

Una suspensión de 20,0 g (169 mmol) de terc.-butilato de potasio en 120 ml dimetilformamida anhidra (DMF) se mezcló con 12,2 g (80 mmol) de decanitrilo y 11,0 g (106 mmol) de metoxiacetato de metilo. Después de haber agitado durante 18 horas

25 a 20-25°C se destiló el disolvente, se absorbió el residuo en agua y se lavó con

112
112

ciclohexano. La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y se extrajo con éter dietílico. Las fases de éter reunidas se lavaron con agua, se secaron y se libraron del disolvente. Quedaron 8,4 g del compuesto indicado en el título como aceite, que se transformó ulteriormente sin purificación ulterior.

5

Ejemplo 2: Preparación de 7-amino-5-metoximetil-6-octil-triazolo(1,5-a)-pirimidina

Una solución de 22,0 g del cetonitrilo del Ejemplo 1, 8,1 g (97 mmol) de 3-amino-1,2,4-triazol y 3,8 g de ácido p-toluenosulfónico en 60 ml de mesitileno se calentó tres horas a 180°C, durante lo cual se destila un poco del disolvente. Entonces se destiló el disolvente por completo y se absorbió el residuo en diclorometano. Después de haber lavado con solución saturada de NaHCO₃. y agua se secó la fase orgánica, se libró del disolvente y se digirió el residuo con éter dietílico. Quedaron 15,0 g del compuesto indicado en el título como cristales blancos del p.f. 180-181°C.

10

15

Tabla I – Compuestos de la fórmula I

No.	R ¹	R ²	R ³	A	Datos físicos (p.f. [°C])
I-1	(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	180-181
I-2	(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N	180-181
I-3	(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₅ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	133-134
I-4	(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	127-128
I-5	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ OCH ₃	H	N	188-189
I-6	(CH ₂) ₉ CH ₃	(CH ₂) ₃ S(4-CH ₃ - C ₆ H ₄)	H	N	125-127

113
113

Ejemplos del efecto contra hongos nocivos

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

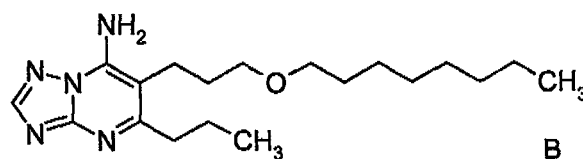
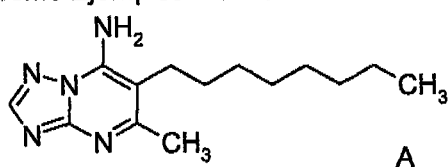
5

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 y el emulsionante Uniperol® EL (humectante con efecto emulsionante y dispersante con base en alquilfenoles etoxilados) en la relación en volumen de disolvente-emulsionante de 99 a 1 ad 10 ml. A continuación, se completó con agua ad 100 ml. Esta solución madre se diluyó con la mezcla de disolvente-emulsionante arriba descrita a la concentración en ingrediente activo abajo indicada. Alternativamente, se usaron los ingredientes activos como formulaciones comerciales y se diluyeron con agua a la concentración indicada.

10

15

Como compuestos comparativos se usaron los principios activos A y B conocidos como Ejemplos 4 o bien 42 de la EP-A 141 317:



20 Ejemplo de aplicación 1 – Actividad contra el añublo en tomates causado por *Phytophthora infestans* en el tratamiento protector

Las hojas de plantas de tomate en macetas se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa de la concentración en principio activo abajo indicada. Uno o bien

114
114

siete días después de la aplicación se infectaron las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Phytophthora infestans*. A continuación, se colocaron las plantas en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de entre 18 y 20 °C. Después de seis días el añublo se había desarrollado tan fuertemente en las plantas de control no
5 tratadas pero infectadas, que la infestación pudo ser determinada visualmente en por cien.

En los ensayos de tratamiento protector de un día, las plantas tratadas con 16 ppm del compuesto I-1 presentaban una infestación de un 15 %, mientras que las plantas tratadas con 16 ppm del compuesto comparativo A estaban infestadas en hasta un
10 70% y las plantas no tratadas estaban infestadas en hasta un 90%. En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm del compuesto I-4 solo presentaban una infestación de 1%, mientras que las plantas tratadas con 250 ppm del compuesto comparativo B y las plantas no tratadas presentaban una infestación de hasta un 90%.

15 En otro ensayo de tratamiento protector de 1 día, las plantas tratadas con 63 ppm de los compuestos I-1, I-4, o bien I-5 estaban infestadas en, como máximo, un 5%, mientras que las plantas no tratadas estaban infestadas en hasta un 90%.

20 En otro ensayo de tratamiento protector de 3 días, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos I-1, o bien I-4 estaban infestadas en, como máximo, un 20%, mientras que las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos comparativos A y B, al igual que las plantas no tratadas estaban infestadas en hasta un 90%.

115
105

En otro ensayo de tratamiento protector de 7 días, las plantas tratadas con 63 ppm del compuesto I-1 estaban infestadas en, como máximo, un 5%, mientras que las plantas no tratadas estaban infestadas en hasta un 90 %.

5 Ejemplo de aplicación 2 – Eficiencia contra la peronospora de la vid causada por *Plasmopara viticola* en el tratamiento protector

Las hojas de vino en macetas se pulverizaron hasta chorrear con una suspensión acuosa de la concentración en principio activo abajo indicada. Uno o bien siete días
10 después de la aplicación se inocularon los lados inversos de las hojas con una suspensión acuosa de esporangios de *Plasmopara viticola*. A continuación, se colocaron las plantas, primero, para 48 horas en una cámara saturada con vapor de agua a 24°C y luego para cinco días en el invernadero a temperaturas de entre 20 y 30°C. Después de este tiempo se colocaron las plantas nuevamente, para acelerar el
15 desarrollo de los esporangios, para 16 horas en una cámara húmeda. Entonces se determinó visualmente la extensión del desarrollo de la infestación en los lados inversos de las hojas.

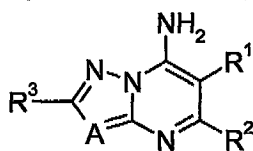
En el ensayo de tratamiento protector de un día, las plantas tratadas con 63 ppm de
20 los compuestos I-1, I-4, o bien I-5 estaban infestadas en, como máximo, un 3%, mientras que las plantas no tratadas estaban infestadas en hasta un 90%.

En otro ensayo de tratamiento protector de 7 días, las plantas tratadas con 250 ppm de los compuestos I-1, o bien I-2 estaban infestadas en, como máximo, un 5 %, mientras
25 que las plantas no tratadas estaban infestadas en hasta un 70 %.

116
116

Reivindicaciones

1. 5-Alcoxialquil-6-alkil-7-amino-azolopirimidinas de la fórmula I



- 5 en la que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

10 R^1 es C_1 - C_{12} -alkilo, C_3 - C_6 -cicloalkilo, C_2 - C_{12} -alquenilo, C_2 - C_{12} -alquinilo, C_2 - C_{12} -alcoxialquilo, C_2 - C_{12} -cianoalkilo y C_8 - C_{18} -benciloxialquilo, pudiendo los grupos en la parte alifática o aromática ser no sustituidos o estar sustituidos por uno a tres grupos R^a :

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_3 - C_6 -cicloalkilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio y $NR^A R^B$;

R^A , R^B significan hidrógeno y C_1 - C_6 -alkilo;

15 R^2 es C_1 - C_{12} -alcoxi- C_1 - C_{12} -alkilo, fenoxi- C_1 - C_{12} -alkilo, C_1 - C_{12} -alquiltio- C_1 - C_{12} -alkilo y feniltio- C_1 - C_{12} -alkilo, en cuyos grupos las cadenas de carbono pueden estar sustituidas por uno a tres grupos R^a y los anillos fenilo pueden estar sustituidos por uno a cinco sustituyentes C_1 - C_6 -alkilo o un grupo R^a ;

20 R^3 es hidrógeno y C_1 - C_6 -alkilo;

H7-1A

A es N y C-R^A.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en los que

5 R² significa C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo y C₁-C₁₂-alquiltio-C₁-C₁₂-alquilo, en cuyos grupos las cadenas de carbono pueden ser no sustituidos o pueden estar sustituidos por uno a tres grupos R^a.

10 3. Compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es C₁-C₁₂-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₂-alquenoilo, C₂-C₁₂-alquinoilo, C₂-C₁₂-alcoxi-alquilo, C₂-C₁₂-cianoalquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₁-C₁₂-hidroxialquilo y C₈-C₁₉-benciloxialquilo; y

15

R² es C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo.

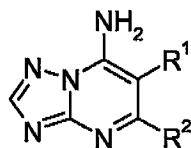
20 4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, en los que R¹ representa una cadena de C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-cianoalquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo o C₁-C₁₂-hidroxialquilo no sustituida, no ramificada o una, dos o tres veces ramificada.

5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4, en los que R² significa C₁-C₁₂-alcoximetilo.

25

118
117

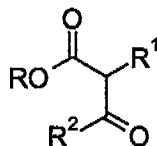
6. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, que corresponden a la fórmula I.A



I.A

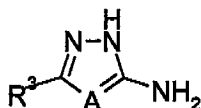
en la que las variables tienen los significados según una de las reivindicaciones 1 a 4.

7. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque se transforman β-ceto ésteres de la fórmula II,



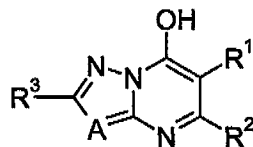
II

donde R significa C₁-C₄-alquilo, con 3-amino-1,2,4-triazol o -pirazol de la fórmula III



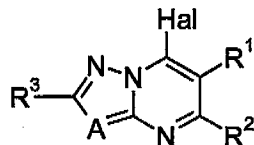
III

en 7-hidroxiazolopirimidinas de la fórmula IV



IV

y se halogenan éstos en compuestos de la fórmula V,



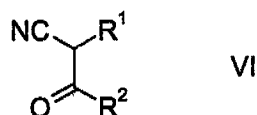
V

donde Hal representa cloro o bromo, y se transforma V con amoníaco.

8. Compuestos de las fórmulas IV y V según la reivindicación 7.

119
119

9. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, caracterizado porque se transforman acilcianuros de la fórmula VI,



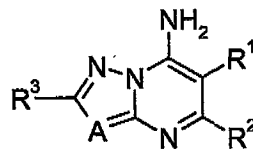
- 5 con 3-amino-1,2,4-triazol o -pirazol de la fórmula III según la reivindicación 7.
10. Producto que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2.
- 10 11. Producto según la reivindicación 10, que contiene otro principio activo adicional.
12. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2 en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.
- 15 13. Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado poque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a la infestación por los hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2.

120
120

5-Alcoxialquil-6-alkuil-7-amino-azolopirimidinas, un procedimiento para su obtención y el uso de las mismas para combatir hongos nocivos, así como productos que las contienen

5 Resumen

5-Alcoxialquil-6-alkuil-7-amino-azolopirimidinas de la fórmula I



en la que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

10

R¹ es alquilo, cicloalquilo, alquenoilo, alquinoilo, alcoxialquilo, cianoalquilo y benciloxi-
alquilo, pudiendo los grupos en la parte alifática o aromática ser no sustituidos o
estar sustituidos por uno a tres grupos R^a:

15

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, cicloalquilo, alcoxi, alquiltio y NR^AR^B;

R^A, R^B significan hidrógeno y alquilo;

R² es alcoxialquilo, fenoxialquilo, alquiltioalquilo y feniltioalquilo, cuyos grupos

20

pueden ser no susituidos o estar sustituidos según la descripción;

R³ es hidrógeno y alquilo;

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2006/050922

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D487/04 A01N43/90

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D

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

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 141 317 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15 May 1985 (1985-05-15) cited in the application siehe Anspruch 1, Tabellen auf S. 10 und 11 und fungizide Wirkung	1-13
X	EP 0 217 218 A2 (BAYER A.-G., FED. REP. GER.) 8 April 1987 (1987-04-08) siehe Tabelle 1 auf S. 5 und Tabelle 2 auf S. 16	8, 10-12
X	WO 98/33799 A1 (POLA CHEMICAL INDUSTRIES, INC., JAPAN) 6 August 1998 (1998-08-06) siehe Beispiel 87 auf S. 102	8
A	DE 16 20 694 A1 (VEB DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN; VEB DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN) 3 December 1970 (1970-12-03) siehe Anspruch 1	1-13

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

G document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 May 2006

Date of mailing of the international search report

23/05/2006

Name and mailing address of the ISA/
European Patent Office, P.B. 5818 Patentkan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Traegler-Goeldel, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2006/050922

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0141317	A	15-05-1985	AU 566960 B2	05-11-1987
			AU 3452684 A	26-04-1985
			CA 1242715 A1	04-10-1988
			CS 248724 B2	12-02-1987
			DD 232635 A5	05-02-1986
			DE 3338292 A1	02-05-1985
			HU 36328 A2	30-09-1985
			IL 73258 A	30-11-1987
			JP 60104089 A	08-06-1985
			NZ 209936 A	31-03-1987
			PL 250093 A2	16-07-1985
			US RE32676 E	24-05-1988
			US 4617303 A	14-10-1986
EP 0217218	A2	08-04-1987	DE 3534651 A1	09-04-1987
			DK 460086 A	29-03-1987
			JP 62081386 A	14-04-1987
			ZA 8607344 A	27-05-1987
WO 9833799	A1	06-08-1998	AU 725356 B2	12-10-2000
			AU 5577798 A	25-08-1998
			CA 2228360 A1	03-08-1998
			EP 1021447 A1	26-07-2000
			JP 10218881 A	18-08-1998
			NO 993731 A	22-09-1999
			US 5942515 A	24-08-1999
DE 1620694	A1	03-12-1970	GB 1148629 A	16-04-1969

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

BASF AKTIENGESELLSCHAFT
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNEDate of mailing (day/month/year)
15 February 2007 (15.02.2007)Applicant's or agent's file reference
0000056351

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP2006/050922International filing date (day/month/year)
14 February 2006 (14.02.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address

SCHIEWECK, Frank
Lindenweg 4
67258 Hessheim
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address

SCHIEWECK, Frank
Burgunderweg 18
67098 Bad Dürkheim
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☒ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Zoltanski Andrzej

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Facsimile No. +41 22 338 89 75

Telephone No. +41 22 338 86 08

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 0000056351	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/IPEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2006/050922	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.02.2006	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 16.02.2005
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt <u>5</u> Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☒ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt <u>3</u> Blätter; dabei handelt es sich um ☒ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben) , der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften). 4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Berichts ☐ Feld Nr. II Priorität ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 2006-12-07	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 27.06.2007	
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 TRAEGLER-GOELDEL, M Tel. +49 89 2399-8278 	

125
126

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der Sprache beruht der Bescheld 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

1-31

In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-13

eingegangen am 08.12.2006 mit Schreiben vom 07.12.2006

- ☐ 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.

128
128

re Punkt V:

1. Stand der Technik

Der relevante Stand der Technik ist in den im Internationale Recherchenbericht zitierten Dokumenten zu sehen:

- D1: EP-A-0 141 317 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15. Mai 1985 (1985-05-15)
in der Anmeldung erwähnt
- D2: EP-A2-0 217 218 (BAYER A.-G. , FED. REP. GER.) 8. April 1987 (1987-04-08)
- D3: WO 98/33799 A1 (POLA CHEMICAL INDUSTRIES, INC., JAPAN) 6. August
1998 (1998-08-06)
- D4: DE 16 20 694 A1 (VEB DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN; VEB
DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN) 3. Dezember 1970 (1970-12-03)

2. Neuheit

Die 7-Amino-pyrazolo- und triazolopyrimidinderivate gemäß Anspruch 1 unterscheiden sich von denen gemäß D1 im Prinzip durch den Austausch der Substituenten in den Positionen 5 und 6. Anspruch 1 gemäß D4 überlappt mit vorliegendem Anspruch 1, offenbart jedoch keine explizit neuheitsschädlichen Beispiele. Die Neuheit von Anspruch 8 (gerichtet auf Zwischenprodukte) gegenüber D2 und D3 wurde hergestellt durch Einführung der bevorzugten Definition des Restes R¹ wie auf S. 6, Z. 19-21 ursprünglich offenbart. Die Ansprüche 10 bis 12 (auf Mittel und Saatgut gerichtet) sind ebenfalls neu, da die Verbindungen 1-3, 7, 9 und 11 bis 14 in Tabelle 1 (S. 5) und der Beispiele 2, 4 und 5 in Tabelle 2 (S. 16) gemäß D2 eine 7-Hydroxygruppe und keine 7-Aminogruppe tragen. Die Ansprüche 1-13 sind daher gemäß Art. 33 (2) PCT als neu gegenüber dem zitierten Stand der Technik zu betrachten.

3. Erfindersche Tätigkeit

Während die Dokumente D2, D3 und D4 7-Hydroxy-triazolopyrimidine mit herbizider Wirkung (D2), Pyrrolopyrazolopyrimidine zur mit bronchodilatativer Wirkung (D3) und 7-Amino-triazolopyrimidinderivate mit koronarerweiternder Wirkung (D4) betreffen, offenbart

129
129

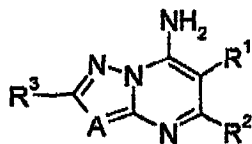
Dokument D1 7-Amino-pyrazolo- und -triazolopyrimidine die, ebenso wie die der vorliegenden Anmeldung als Fungizide verwendet werden können. Der strukturelle Unterschied ist im Austausch der Substituenten in den Positionen 5 und 6 zu sehen: Während gemäß D1 in Position 5 ein Alkylrest sein muss und in Position 6 ein Alkyl- oder ein Alkoxyalkylrest, muss anmeldungsgemäß dieser substituierte Oxyalkylrest in Position 5 sein und der (substituierte) Alkylrest in Position 6. Der Anmelder hat durch einen Vergleich mit der strukturell nächsten Verbindung 42 gemäß D1 gezeigt, von welcher sich die anmeldungsgemäße Verbindung I-4 nur durch den $\text{CH}_2\text{-O-CH}_3$ anstelle des $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$ in Position 5 unterscheidet, dass die anmeldungsgemäßen Verbindungen auf Grund dieses essentiellen Merkmals einen überraschenden Effekt aufweisen. Der Gegenstand von Anspruch 1 und den davon abhängigen 2 bis 7 und 10 bis 13 kann daher als den Erfordernissen von Art. 33 (3) PCT genügend betrachtet werden. Das gleiche gilt für die Zwischenprodukte gemäß Anspruch 8, welche ebenfalls das essentielle Merkmal tragen.

4. Industrielle Anwendbarkeit

Dagegen bestehen keine Bedenken, da die anmeldungsgemäßen Verbindungen zur Herstellung von industriellen Produkten verwendet werden können.

Patentansprüche

1. 5-Alkoxyalkyl-6-alkyl-7-amino-azolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R^1 C_1 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_2 - C_{12} -Alkenyl, C_2 - C_{12} -Alkynyl, C_2 - C_{12} -Alkoxyalkyl, C_2 - C_{12} -Cyanoalkyl und C_6 - C_{10} -Benzyloxyalkyl, wobei die Gruppen im aliphatischen oder aromatischen Teil unsubstituiert oder durch eine bis drei Gruppen R^a substituiert sein können:

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio und $NR^A R^B$;

R^A , R^B Wasserstoff und C_1 - C_6 -Alkyl;

15

R^2 C_1 - C_{12} -Alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, Phenoxy- C_1 - C_{12} -alkyl, C_1 - C_{12} -Alkylthio- C_1 - C_{12} -alkyl und Phenylthio- C_1 - C_{12} -alkyl, in welchen Gruppen die Kohlenstoffketten durch eine bis drei Gruppen R^a substituiert und die Phenylringe durch einen bis fünf Substituenten aus C_1 - C_6 -Alkyl oder einer Gruppe R^a substituiert sein können;

20

R^3 Wasserstoff und C_1 - C_6 -Alkyl;

A N und C- R^A .

25

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der

30 R^2 C_1 - C_{12} -Alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl und C_1 - C_{12} -Alkylthio- C_1 - C_{12} -alkyl, in welchen Gruppen die Kohlenstoffketten unsubstituiert oder durch eine bis drei Gruppen R^a substituiert sein können.

30

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

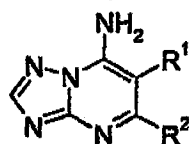
35 R^1 C_1 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_2 - C_{12} -Alkenyl, C_2 - C_{12} -Alkynyl, C_2 - C_{12} -Alkoxyalkyl, C_2 - C_{12} -Cyanoalkyl, C_1 - C_{12} -Halogenalkyl, C_1 - C_{12} -Hydroxyalkyl und C_6 - C_{10} -Benzyloxyalkyl; und

R^2 C_1 - C_{12} -Alkoxy- C_1 - C_{12} -alkyl.

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, worin R¹ für eine unsubstituierte unverzweigte oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte C₁-C₁₂-Alkyl-, C₂-C₁₂-Cyanoalkyl-, C₁-C₁₂-Halogenalkyl- oder C₁-C₁₂-Hydroxyalkylkette steht.

5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, worin R² für C₁-C₁₂-Alkoxymethyl steht.

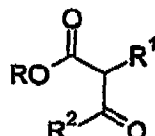
- 10 6. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.A



I.A

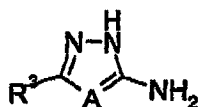
entsprechen, in der die Variablen die Bedeutung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 aufweisen.

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



II

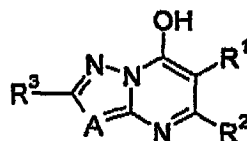
in der R für C₁-C₄-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol oder -pyrazol der Formel III



III

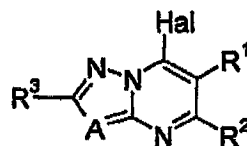
20

zu 7-Hydroxyazolopyrimidinen der Formel IV



IV

umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,



V

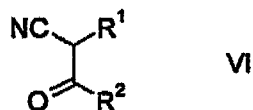
25

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

34

8. Verbindungen der Formeln IV und V gemäß Anspruch 7, worin R¹ für eine unverzweigte oder ein-, zwei-, drei- oder mehrfach verzweigte C₅-C₁₂-Alkylgruppe oder C₅-C₁₀-Alkoxypropylgruppe steht.

- 5 9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,



mit 3-Amino-1,2,4-triazol oder -pyrazol der Formel III gemäß Anspruch 7 umgesetzt.

10

10. Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2.

11. Mittel gemäß Anspruch 10, enthaltend einen weiteren Wirkstoff.

15

12. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 1 bis 1000 g pro 100 kg.

20

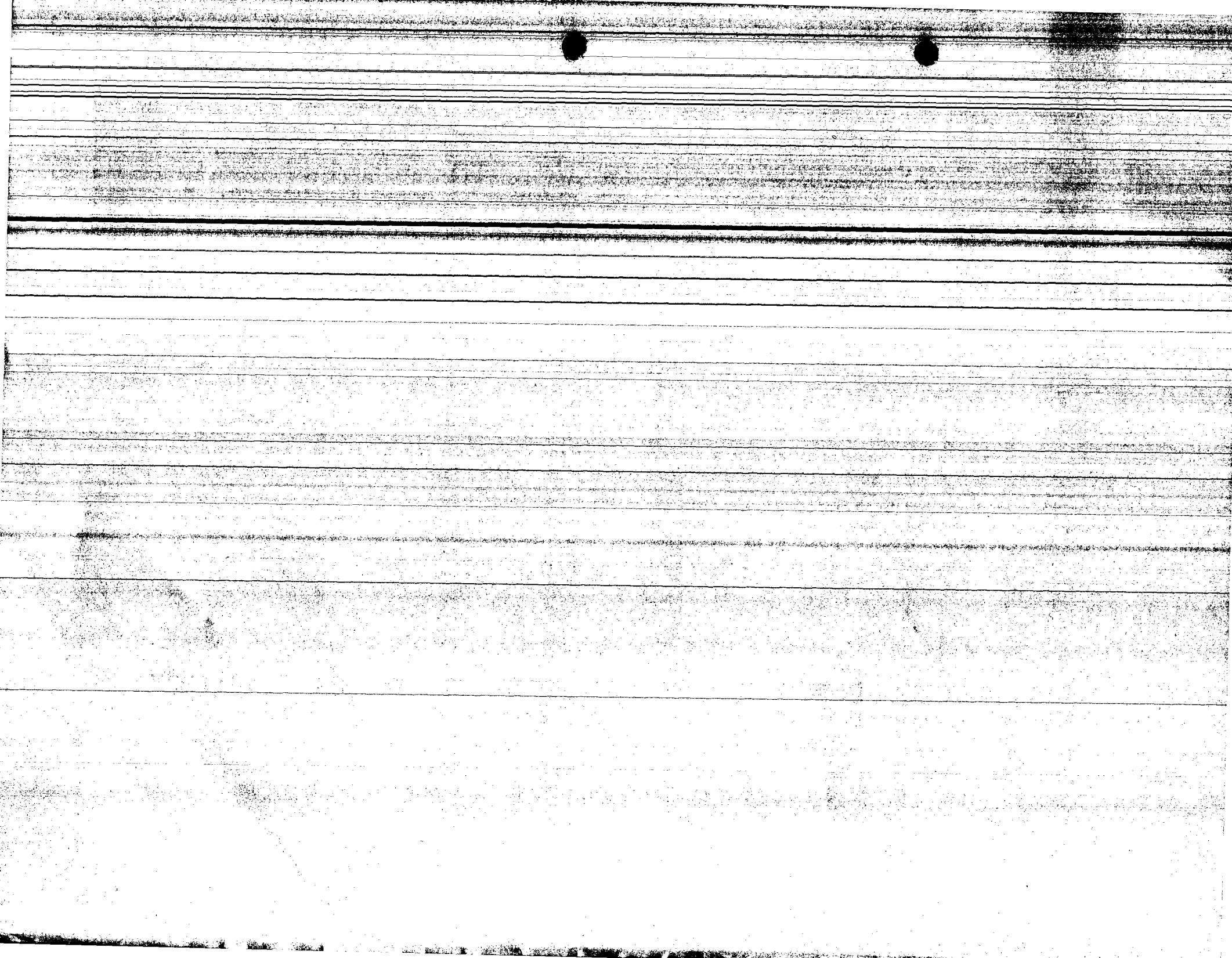
13. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 behandelt.

123
133

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

● PARA REALIZAR EL EXAMEN DE

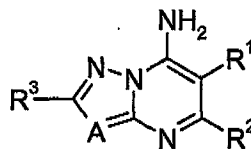
PATENTABILIDAD



134
139

Reivindicaciones

1. 5-Alcoxialquil-6-alkil-7-amino-azolopirimidinas de la fórmula I



5 en la que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

10 R^1 es C_1 - C_{12} -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_2 - C_{12} -alquenilo, C_2 - C_{12} -alquinilo, C_2 - C_{12} -alcoxialquilo, C_2 - C_{12} -cianoalquilo y C_8 - C_{19} -benciloxialquilo, pudiendo los grupos en la parte alifática o aromática ser no sustituidos o estar sustituidos por uno a tres grupos R^a :

R^a es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio y $NR^A R^B$;

R^A , R^B significan hidrógeno y C_1 - C_6 -alquilo;

15 R^2 es C_1 - C_{12} -alcoxi- C_1 - C_{12} -alquilo, fenoxi- C_1 - C_{12} -alquilo, C_1 - C_{12} -alquiltio- C_1 - C_{12} -alquilo y feniltio- C_1 - C_{12} -alquilo, en cuyos grupos las cadenas de carbono pueden estar sustituidas por uno a tres grupos R^a y los anillos fenilo pueden estar sustituidos por uno a cinco sustituyentes C_1 - C_6 -alquilo o un grupo R^a ;

20

R^3 es hidrógeno y C_1 - C_6 -alquilo;

135
135

A es N y C-R^A.

2. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, en los que

5 R² significa C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo y C₁-C₁₂-alquiltio-C₁-C₁₂-alquilo, en cuyos grupos las cadenas de carbono pueden ser no sustituidas o pueden estar sustituidas por uno a tres grupos R^a.

10 3. Compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es C₁-C₁₂-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₁₂-alquenilo, C₂-C₁₂-alquinilo, C₂-C₁₂-alcoxialquilo, C₂-C₁₂-cianoalquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo, C₁-C₁₂-hidroxialquilo y C₈-C₁₀-benciloxialquilo; y

15

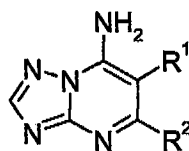
R² es C₁-C₁₂-alcoxi-C₁-C₁₂-alquilo.

20 4. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 3, en los que R¹ representa una cadena de C₁-C₁₂-alquilo, C₂-C₁₂-cianoalquilo, C₁-C₁₂-halógenoalquilo o C₁-C₁₂-hidroxialquilo no sustituida, no ramificada o una, dos o tres veces ramificada.

25 5. Compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 4, en los que R² significa C₁-C₁₂-alcoximetilo.

126
136

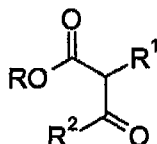
6. Compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1, que corresponden a la fórmula I.A



I.A

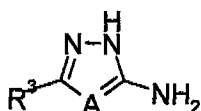
en la que las variables tienen los significados según una de las reivindicaciones 1 a 4.

7. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque se transforman β -ceto ésteres de la fórmula II,



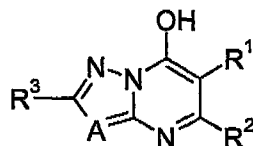
II

donde R significa C₁-C₄-alquilo, con 3-amino-1,2,4-triazol o -pirazol de la fórmula III



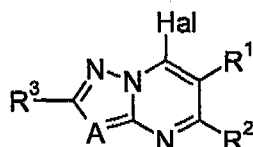
III

en 7-hidroxiazolopirimidinas de la fórmula IV



IV

y se halogenan éstos en compuestos de la fórmula V,



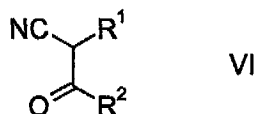
V

donde Hal representa cloro o bromo, y se transforma V con amoníaco.

137
137

8. Compuestos de las fórmulas IV y V según la reivindicación 7, donde R¹ representa un grupo C₅-C₁₂-alquilo o C₅-C₁₀-alcoxipropilo no ramificado o una, dos, tres o más veces ramificado.

- 5 9. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2, caracterizado porque se transforman acilcianuros de la fórmula VI,



con 3-amino-1,2,4-triazol o -pirazol de la fórmula III según la reivindicación 7.

10

10. Producto que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2.

11. Producto según la reivindicación 10, que contiene otro principio activo adicional.

15

12. Semillas que contienen un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2 en una cantidad de 1 a 1000 g por 100 kg.

20

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 infestación por los hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1 ó 2.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 000178

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 72,880
FECHA : SEPTIEMBRE 10 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-094234- -00000-0000

Fecha: 2007-09-12 17:06:25 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra: 11 PATENTLIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 411 PRESENTACION Folios: 140

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	VR. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	63769921	10/09/2007	\$1,530,000.00

***** CONCEPTO *****

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. _____

Bob 00361-841-171-8



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

PATENTE DE INVENCION

[9]

MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente [4]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [4]
- ◆ Descripción de la invención [4]
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes [4]
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [4]

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Firma Responsable

12 SET. 2007

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

141

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 142

2020
Bogotá D.C.,

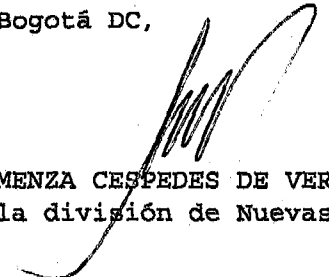
Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	7 94234
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/050922
	Fecha inicio fase nacional	16/09/07
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	3981
	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,

02 OCT. 2007


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

jfernand