



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

① Número de publicación: 2 358 615

(51) Int. Cl.:

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 405/14 (2006.01)

C07D 409/14 (2006.01)

A01N 43/707 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

Т3

- 96 Número de solicitud europea: 07727983 .4
- 96 Fecha de presentación : **11.04.2007**
- 97 Número de publicación de la solicitud: 2010514 97 Fecha de publicación de la solicitud: 07.01.2009
- 54) Título: 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazinas como fungicidas.
- (30) Prioridad: **12.04.2006 EP 06007743**

(73) Titular/es: BASF SE 67056 Ludwigshafen, DE

- (45) Fecha de publicación de la mención BOPI: 12.05.2011
- (72) Inventor/es: Grammenos, Wassilios; Grote, Thomas; Dietz, Jochen; Lohmann, Jan Klaas; Renner, Jens; Müller, Bernd y Ulmschneider, Sarah
- (45) Fecha de la publicación del folleto de la patente: 12.05.2011
- (74) Agente: Carvajal y Urquijo, Isabel

ES 2 358 615 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazinas como fungicidas

15

20

30

35

La presente invención se refiere a 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazinas y su uso para combatir hongos dañinos así como a productos fitoprotectores que contienen compuestos de este tipo como componente activo.

La EP-A 234 104 describe 2-(piridin-2-il)-pirimidinas que tienen un grupo alquilo en la posición 6 del residuo de piridina y que pueden tener en la posición 3,4 del anillo de pirimidina un anillo de 5 o de 6 saturado, fusionado. Los compuestos son adecuados para combatir hongos patógenos para las plantas (hongos dañinos).

De la US 4,873,248 se conocen 2-(piridin-2-il)-pirimidinas con acción fungicida que tienen en la posición 4 del anillo de pirimidina un anillo fenilo opcionalmente sustituido.

La EP-A 259 139 describe 2-(piridin-2-il)-pirimidinas que presentan en la posición 6 del residuo de piridina un grupo fenilo opcionalmente sustituido y que pueden tener en la posición 3,4 del anillo pirimidina un anillo de 5 o 6, saturado, fusionado. Los compuestos también son adecuados para combatir hongos fitopatógenos (hongos dañinos).

La WO 2006/010570 describe compuestos activos como fungicidas de 2-(6-fenilpiridin-2-il)-pirimidina de la siguiente fórmula B:

$$(R^g)_m \xrightarrow{N} N \xrightarrow{N} (R^k)_k$$

$$(B)$$

en la cual: k representa 0, 1, 2 o 3, m representa 0, 1, 2, 3, 4 o 5 y n representa 1, 2, 3, 4 o 5, el sustituyente R^9 significa entre otros halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C_1 - C_4 , haloalquilo de C_1 - C_4 , alcoxi de C_1 - C_4 , haloalcoxi de C_1 - C_4 , alquenilo de C_2 - C_4 , alquinilo de C_2 - C_4 , cicloalquilo de C_3 - C_8 , alcoxi de C_1 - C_4 -alquilo de C_1 - C_4 , amino, fenoxi, etc., R^h significa haloalquilo de C_1 - C_4 , alcoxi de C_1 - C_4 , haloalcoxi de C_1 - C_4 , hidroxi, halógeno. CN o NO₂ y R^k representa alquilo de C_1 - C_4 .

En Alfred A. Schilt et al., Talanta, 21(8), 1974, 831-836 (D1), se describen 39 nuevos compuestos de ferroína, por ejemplo 2,6-bis-(5,6-dimetil-1,2,4-triazin-3-il)piridina. Se investigaron mediante fotoespectrometría sus propiedades de quelación y cromogénicas en reacciones con hierro (II), cobre (II).

En Alfred A. Schilt et al., Talanta, 24(11), 1977, 685-687 (D2), se describen 36 nuevos compuestos de ferroína que son adecuados para la detección y el análisis de trazas de hierro (II), cobre (I) y cobalto (II), por ejemplo 3-[6-(2,2' - bipiridil)]-5,6-dimetil-1,2,4-triazina.

En M. G. B. Drew et al., Inorganic Chemistry Communications 4(9), 2001, 462-466 (D3), se describen 2,6-bis(5,6-dialquil-1,2,4-triazin-3-il)-piridinas que se cristalizan mediante adición de nitrato de lantánido (III) en complejos diméricos.

En Sonia Colette et al., Inorganic Chemistry 41(26), 2002, 7031-7041 (D4), se describen 2,6-bis(5,6-dialquil-1,2,4-triazin-3-il)-piridinas que se investigan mediante masa-espectrometría como ligando tridentado para la formación de complejo de europio (III).

En M. G. B. Drew et al., Journal of Alloys and Compounds, 374(1-2), 2004, 408-415 (D5), se describen (piridil)-1,3,5-triazinas y (triazin-3-il)piridinas que se han investigado por medio de estudios QSAR para su aplicación en la optimización de la separación de actínidos de europio (III).

En Michael J. Hudson et al., Dalton Transaction (9), 2003, 1675-1685 (D6), se describen bis(1,2,4-triazin-3-il)piridinas para la separación de americio (III) de europio (III).

En F.-A. Alphonse et al., Database CAPLUS [Online] Chemical Abstracts Service, bajo el número de acceso 2006:895172 (D7) se describen 2,6-bis-(5,6-dimetoxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina y 2,6-bis-(5,6-dietoxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina para la complejación selectiva de cationes metálicos.

En Yuezhou Wei et al., Database CAPLUS [Online] Chemical Abstracts Service, bajo el número de acceso 2003:109406 (D8) se describen 2,6-bis-(5,6-dialquil-1,2,4-triazin-3-il)piridinas para la presentación de resinas de extracción para actínidos y lantánidos trivalentes.

La EP-A1-0407888 describe pirimido[5,4-e]-as-triazin-5,7(6H,8H)-dionas, que presentan actividad herbicida.

La US-A-4,033,752 describe piridiltriazinonas que pueden alquilarse o alcoxilarse en el átomo Ca. Estos compuestos tienen propiedades herbicidas y fungicidas.

Las 2-(piridin-2-il)-pirimidinas conocidas del estado de la técnica no son satisfactorias en parte respecto de su efecto fungicida o poseen propiedades indeseadas, como una baja tolerancia hacia las plantas provechosas.

El problema en que se fundamenta la presente invención consiste en proporcionar nuevos compuestos con actividad fungicida mejorada y/o una tolerancia mejorada hacia las plantas provechosas.

Este problema se resuelve de manera sorprendente por los compuestos de 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazina de la fórmula general I

en la cual:

5

15

20

25

30

35

40

 R^1 , R^2 , independientemente uno de otro, representan OH, halógeno, NO_2 , NH_2 , alquilo de C_1 - C_8 , alcoxi de C_1 - C_8 , haloalquilo de C_1 - C_8 , haloalcoxi de C_1 - C_8 , alquilamino de C_1 - C_8 o di(alquil C_1 - C_8)amino, o pueden formar en conjunto con los átomos de C a los que están enlazados, un carbociclo o heterociclo saturado de 5, 6 ó 7 miembros que tiene como miembros de anillo, además de los carbonos, uno o dos heteroátomos seleccionados entre oxígeno y azufre, en cuyo caso el carbociclo y el heterociclo no tienen sustituciones o presentan 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo de C_1 - C_4 como sustituyentes;

 R^3 representa hidrógeno, alquilo de C_1 - C_4 , alcoxi de C_1 - C_4 , haloalquilo de C_1 - C_4 , haloalcoxi de C_1 - C_4 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , cicloalquilmetilo de C_3 - C_6 o halógeno;

 R^4 representa hidrógeno, alquilo de C_1 - C_4 , alcoxi de C_1 - C_4 , haloalquilo de C_1 - C_4 , haloalcoxi de C_1 - C_4 o halógeno;

 R^5 representa alquilo de C_1 - C_8 , haloalquilo de C_1 - C_8 , alcoxi de C_1 - C_8 , haloalcoxi de C_1 - C_8 , cicloalquiloxi de C_3 - C_8 , heteroarilo de 5 o 6 miembros, fenilo, fenoxi, bencilo, benciloxi, heteroarilmetilo de 5 o 6 miembros o heteroariloxi de 5 ó 6 miembros, en cuyo caso los residuos cíclicos nombrados previamente no tienen sustituciones o pueden tener 1, 2, 3, 4 ó 5 residuos R^a , en cuyo caso

 R^a se selecciona entre OH, SH, halógeno, NO_2 , NH_2 , CN, COOH, alquilo de C_1 - C_8 , alcoxi de C_1 - C_8 , haloalquilo de C_1 - C_8 , haloalcoxi de C_1 - C_8 , alquilamino de C_1 - C_8 , di(alquilo de C_1 - C_8) amino, alquiltio de C_1 - C_8 , haloalquiltio de C_1 - C_8 , haloalquilsulfinilo de C_1 - C_8 , haloalquilsulfinilo de C_1 - C_8 , haloalquilsulfonilo de C_1 - C_8 , no haloalquilsulfonilo de C_1 - C_8 , haloalquilsulfonilo de C_1 - C_8

ES 2 358 615 T3

De esta manera son objeto de la presente invención las 3-(piridin-2-il)-triazinas de la fórmula general I y sus sales tolerables en la agricultura, a excepción de los siguientes compuestos descritos en los documentos D1 –D8 citados preliminarmente:

- 2,6-bis-(5,6-dimetil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 5 2,6-bis-(5,6-dietil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 2,6-bis-(5,6-dipropil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 2,6-bis-(5,6-diisopropil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 2,6-bis-(5,6-dibutil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 2,6-bis-(5,6-diisobutil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-dipentil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 2,6-bis-(5,6-dihexil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 2,6-bis-(5,6-diheptil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
 - 3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dimetil-1,2,4-triazina;
 - 3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dietil-1,2,4-triazina;
- 15 3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dipropil-1,2,4-triazina;
 - 3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dibutil-1,2,4-triazina;
 - 5,6-dietil-3-[6-(2-piridil)-4-metoxipiridin-2-il]-1,2,4-triazina;
 - 3-(6-metilpiridin-2-il)-5,6-dimetil-1,2,4-triazina;
 - 3-(6-metilpiridin-2-il)-5,6-dietil-1,2,4-triazina;
- 20 2,6-bis-(5,6-dimetoxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina; y

25

2,6-bis-(5,6-dietoxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina.

Además, es objeto de la presente invención el uso de las 3-(piridin-2-il)-triazinas de la fórmula general I y de sus sales tolerables en la agricultura para combatir hongos fitopatógenos (= hongos dañinos), así como un método para combatir hongos fitopatógenos, el cual se caracteriza porque se tratan los hongos o los materiales, vegetales, el suelo o las semillas a protegerse frente a la infestación de hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula general I y/o con una sal de I tolerable en la agricultura.

Además, es objeto de la presente invención un producto para combatir hongos dañinos que contiene al menos un compuesto 3-(piridin-2-il)-triazina de la fórmula general I y/o una sal del mismo tolerable en la agricultura y al menos un material de soporte líquido o sólido.

- 30 Los compuestos de la fórmula I y sus tautómeros pueden tener uno o varios centros de quiralidad dependiendo de un patrón de sustitución y se encuentran presentes entonces como enantiómeros puros o diaestereómeros puros como mezclas de enantiómeros o diaestereómeros. Son objeto de la invención tanto los enantiómeros o diastereómeros puros, como también sus mezclas.
- Por sales útiles en la agricultura se toman en consideración ante todo las sales de aquellos cationes, o las sales de adición ácidas de aquellos ácidos, cuyos cationes o aniones no afectan negativamente el efecto fungicida de los compuestos I. Así, como cationes se toman en consideración particularmente los iones de los metales alcalinos, preferiblemente sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, cinc y hierro, así como el ion amonio que puede tener, si se desea, de uno a cuatro sustituyentes alquilo de C₁-C₄ y/o un sustituyente fenilo o bencilo, preferiblemente

diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutilamonio, trimetilbencilamonio, además iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(alquil de C_1 - C_4)sulfonio e iones de sulfoxonio, preferiblemente tri(alquil de C_1 - C_4)sulfoxonio.

Aniones de sales de adición ácidas útiles son, en primer lugar, cloruro, bromuro, fluoruro, hidrosulfato, sulfato, dihidrofosfato, hidrofosfato, fosfato, nitrato, hidrocarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, así como los aniones de ácidos alcanoicos de C₁-C₄, preferentemente formiato, acetato, propionato y butirato. Estos pueden formarse mediante la reacción de I con un ácido del anión correspondiente, preferentemente del ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico o ácido nítrico.

En las definiciones de las variables indicadas en las fórmulas anteriores se emplean conceptos genéricos que de manera generalmente representativa representan los sustituyentes respectivos. El significado C_n-C_m indica el número respectivamente posible de átomos de carbono en los sustituyentes respectivos o parte de los sustituyentes:

Halógeno: flúor, cloro, bromo y yodo;

5

10

15

20

25

35

45

Alquilo así como todas las partes de alquilo en alcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfinilo, alquilamino, dialquilamino, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo: residuos de hidrocarburos saturados, de cadena recta o ramificada con 1 a 8 (alquilo de C_1 - C_8), frecuentemente 1 a 6 (alquilo de C_1 - C_6) y en particular 1 a 4 átomos de carbono (alquilo de C_1 - C_4) como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 1,1-etilbutilo, 1,1-et

Haloalquilo así como todas las partes de haloalquilo en haloalcoxi y haloalquiltio: grupos alquilo de cadena recta o ramificada con 1 a 8 y en particular 1 a 4 átomos de carbono (como se nombra previamente), en cuyo caso en estos grupos los átomos de hidrógeno puede reemplazarse parcial o totalmente por átomos de halógeno como se nombran previamente y en particular flúor o cloro, en particular haloalquilo de C_1 - C_2 como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorofluorometilo, 1-cloroetilo, 1-brometilo, 1-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,1,1,1-trifluoroprop-2-ilo:

Alquenilo: residuos de hidrocarburos insaturados una vez, de cadena recta o ramificados, con 2 a 8 o 3 a 8 átomos de carbono y un enlace doble en una posición cualquiera, por ejemplo etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo;

Alquinilo: grupos de hidrocarburos de cadena recta o ramificados, con 2 a 8 o 3 a 8 átomos de carbono y un enlace triple en cualquier posición, por ejemplo etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo;

Cicloalquilo: grupos de hidrocarburos monocíclicos, saturados, con 3 a 8, preferentemente hasta 6 miembros de anillo de carbono, como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

Cicloalquilmetilo: es un residuo de cicloalquilo, tal como se nombra previamente, el cual está enlazado a través de un grupo metileno (CH_2) .

40 Alquilamino y las partes de alquilamino en alquilaminocarbonilo: es un grupo alquilo enlazado a través de un grupo NH, donde alquilo representa uno de los residuos alquilo nombrados previamente con 1 a 8 átomos de C, como metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino, n-butilamino y similares;

Dialquilamino y las partes de dialquilamino en dialquilaminocarbonilo: es un residuo de la fórmula N(alquilo)₂, donde alquilo representa uno de los residuos alquilo nombrados previamente, con 1 a 8 átomos de C, por ejemplo representa dimetilamino, dietilamino, metiletilamino, N-metil-N-propilamino y similares;

Alcoxi y las partes de alcoxi en alcoxicarbonilo: representa un grupo de alquilo enlazado a través de un oxígeno, con 1 a 8, en particular 1 a 6 y especialmente 1 a 4 átomos de C, por ejemplo metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi o 1,1-dimetiletoxi;

Alcoxicarbonilo: representa un residuo alcoxi enlazado a través de un grupo carbonilo, como se nombró 50 previamente;

Alquiltio: representa un grupo alquilo enlazado a través de un átomo de azufre, como se nombró previamente;

Alquilsulfinilo: representa un grupo alquilo enlazado a través de un grupo S(=O)-como se nombró previamente;

Alquilsulfonilo: representa un grupos alquilo enlazado a través de un grupo S(=O)2 como se nombró previamente;

Haloalcoxi: representa un residuo alcoxi con 1 a 8, en particular 1 a 6 y especialmente 1 a 4 átomos de C, como se nombró previamente, el cual se sustituye parcial o totalmente por flúor, cloro, bromo y/o yodo, preferentemente por flúor, es decir, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂CI, OCHCI₂, OCCI₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yododetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2,2-difluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoretoxi, 1-(CH₂CI)-2-cloroetoxi, 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi;

Alquileno: representa una cadena de hidrocarburo linear, saturada, con 2 a 6 y en particular 2 a 4 átomos de C, como etan-1,2-diilo, propan-1,3-diilo, butan-1,4-diilo, pentan-1,5-diilo o hexan-1,6-diilo.

- Heterociclo saturado de 5, 6 ó 7 miembros el cual tiene, en calidad de miembros de anillo, uno o dos heteroátomos seleccionados entre oxígeno y azufre: un anillo sustituido de átomos de carbono y 1 ó 2 heteroátomos seleccionados entre azufre y oxigeno, en cuyo caso el número total de los átomos del anillo (miembros de anillo) es de 5, 6 ó 7, por ejemplo: oxolano, oxepano, oxano (tetrahidropirano), 1,3-dioxolano, 1,4-dioxano, tiolano, tiano, tiepano, 1,3-ditiolano, 1,3-ditiolano, 1,4-ditiano;
- Heteroarilo de de 5 ó 6 miembros: un anillo aromático de 5 o 6 miembros que, además de carbono, tiene 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos como miembros de anillo, en cuyo caso los heteroátomos se seleccionan de manera típica entre oxígeno, nitrógeno y azufre, en particular:
 - Heteroarilo de 5 miembros que tiene 1, 2, 3 ó 4 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, como 1-, 2- ó 3-pirrolilo, 1-, 3- ó 4-pirazolilo, 1-, 2- ó 4-imidazolilo,
- 25 1,2,3-[1H]-triazol-1-ilo, 1,2,3-[2H]-triazol-2-ilo, 1,2,3-[1H]-triazol-4-ilo,

35

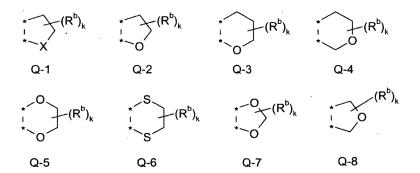
45

- 1,2,3-[1H]-triazol-5-ilo, 1,2,3-[2H]-triazol-4-ilo, 1,2,4-[1H]-triazol-1-ilo,
- 1,2,4-[1H]-triazol-3-ilo, 1,2,4-[1H]-triazol-5-ilo, 1,2,4-[4H]-triazol-4-ilo,
- 1,2,4-[4H]-triazol-3-ilo, [1H]-tetrazol-1-ilo, [1H]-tetrazol-5-ilo, [2H]-tetrazol-2-ilo y [2H]-tetrazol-5-ilo;
- Heteroarilo de 5 miembros, que tiene 1 heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre y opcionalmente 1, 2 ó 3 Átomos de nitrógeno como miembros de anillo, por ejemplo 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 3- o 4- isoxazolilo, 3- o 4- isotiazolilo, 2-, 4- ó 5-oxazolilo, 2-, 4 ó 5-tiazolilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo y 1,3,4-oxadiazol-2-ilo;
 - Heteroarilo de 6 miembros que tiene 1, 2, 3 ó 4 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, tales como 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 1,2,4-triazin-3-ilo, 1,2,4-triazin-5-ilo, 1,2,4-triazin-6-ilo y 1,3,5-triazinilo.

En consideración al uso como fungicidas se prefieren aquellos compuestos de la fórmula I en los que las variables R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 , independientemente uno de otro, y en particular en combinación tienen los siguientes significados:

Según una primera forma de realización de la invención R^1 y R^2 significan, independientemente uno de otro, residuos monovalentes. R^1 y R^2 en este caso pueden ser iguales o diferentes. Se seleccionan entonces preferentemente entre flúor, cloro, alquilo de C_1 - C_4 , especialmente metilo, etilo o n-propilo, además metoxi, etoxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 y $OCHF_2$.

Según una segunda forma de realización R^1 y R^2 forman en conjunto con los átomos de C a los que están enlazados un carbociclo o un heterociclo saturado de 5, 6 ó 7 miembros que se define como antes y puede tener uno o varios grupos alquilo de C_1 - C_4 en calidad de sustituyentes. En esta forma de realización R^1 y R^2 representan conjuntamente con los átomos de C del anillo de triazina, a los que están enlazados, preferentemente uno de los siguientes anillos:



donde

10

15

20

25

30

* designa los átomos del anillo de triazina;

k significa 0, 1, 2, 3 ó 4;

5 R^b representa alquilo de C₁-C₄, en particular metilo; y

X representa $(CH_2)_n$ con n = 1, 2 \(\delta \) 3.

Los residuos R^b pueden ubicarse en cualquiera de los átomos de carbono de este anillo y, por ejemplo, si $k \ne 0$, entonces 1, 2, 3 ó 4 de los átomos de hidrógeno en $(CH_2)_n$ pueden reemplazarse por R^b . La orientación de los residuos Q -2, Q-3 y Q-4 respecto del anillo de triazina es cualquiera. Entre los residuos Q-1 a Q-8 se prefiere en particular el residuo Q-1 y especialmente residuos Q-1 con n = 2 ó 3. La variable k representa en particular 0, 1 ó 2.

 R^3 representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo de C_1 - C_4 , especialmente metilo, etilo, isopropilo o tercbutilo, metoxi, etoxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 o $OCHF_2$, en particular representa hidrógeno o metilo. Además, particularmente se prefieren compuestos de la fórmula I, donde R^3 representa cloro. Además, particularmente se prefieren compuestos de la fórmula I, donde R^3 representa CF_3 . Particularmente se prefieren compuestos de la fórmula I, donde R^3 representa metoxi o etoxi.

 R^4 representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo de C_1 - C_4 , especialmente metilo o etilo, metoxi, etoxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 o $OCHF_2$. En particular, R^4 representa hidrógeno, fluór, cloro o metilo.

En compuestos preferidos de la fórmula I R^5 representa fenilo, fenoxi o bencilo, en cuyo caso el anillo fenilo está sin sustituir en los tres residuos previamente mencionados o tiene 1, 2, 3, 4 ó 5 residuos R^a , en particular 1, 2 ó 3 residuos R^a .

Se seleccionan residuos R^a preferidos entre halógeno, alquilo de C_1 - C_4 , haloalquilo de C_1 - C_2 , alcoxi de C_1 - C_4 , haloalcoxi de C_1 - C_2 , alquiltio de C_1 - C_4 , alquilcarbonilo de C_1 - C_4 , alcoxicarbonilo de C_1 - C_4 , y residuos de la fórmula C(=N-O) alquilo de C_1 - C_4 , alquilcarbonilo de C_1 - C_4 , alquilcarbonilo de C_1 - C_4 . En particular se prefieren los residuos R^a seleccionados entre halógeno, especialmente cloro o flúor, metilo, metoxi, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometoxi, difluorometoxi y metiltio.

Según una forma preferida de realización de la invención R^5 representa en la fórmula I fenilo, fenoxi o bencilo, donde el anillo fenilo tiene 1, 2, 3, 4 ó 5 y en particular 1, 2 ó 3 residuos R^a , en cuyo caso los residuos R^a se seleccionan preferentemente entre los residuos R^a nombrados como preferidos y en particular entre los residuos R^a nombrados como particularmente preferidos. En esta forma de realización el residuo fenilo en fenilo, fenoxi o bencilo representan un residuo de la fórmula P:

$$R^{12}$$
 # R^{15} (P)

donde # es el sitio de conexión con el anillo de piridina y R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} representan hidrógeno o por lo menos uno de estos residuos, por ejemplo 1, 2, 3, 4 ó 5 de estos residuos tienen uno de los significados indicados para R^a , en particular un significado indicado como preferido o particularmente preferido. En una forma preferida de realización, al menos uno y especialmente 1, 2 ó 3 de los residuos R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} o R^{15} es diferente de hidrógeno.

5 En particular:

- R¹¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, CH₃, OCH₃, OCHF₂, OCF₃ o CF₃;
- R^{12} , R^{14} significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, cloro, flúor, CH_3 , OCH_3 , OCH_2 , OCF_3 o CF_3 , en cuyo caso uno de los residuos R^{12} y R^{14} también pueden representar NO_2 , $C(O)CH_3$ o $COOCH_3$; en particular, R^{12} y R^{14} representan hidrógeno, flúor, metilo o trifluorometilo;
- significa hidrógeno, flúor, cloro, ciano, OH, CHO, NO₂, NH₂, metilamino, di- metilamino, dietilamino, alquilo de C₁-C₄, especialmente CH₃, C₂H₅, CH(CH₃)₂, cicloalquilo de C₃-C₈, especialmente ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo, alcoxi de C₁-C₄, especialmente OCH₃, alquilitio de C₁-C₄, especialmente OCH₃, haloalcoxi de C₁-C₄, especialmente CF₃, haloalcoxi de C₁-C₄, especialmente OCHF₂ o OCF₃, o CO(A²), donde A² representa alquilo de C₁-C₄, especialmente metilo, o representa alcoxi de C₁-C₄, especialmente OCH₃, o un grupo C(R^{13a})=NOR^{13b}, donde R^{13a} representa hidrógeno o metilo y R^{13b} representa alquilo de C₁-C₄, propargilo o alilo o R¹² y R¹³ iuntos forman un grupo O-CH₂-O; y
 - R^{15} significa hidrógeno, flúor, cloro, o alquilo de C_1 - C_4 , especialmente CH_3 , en particular hidrógeno o flúor.
- Siempre que más de uno de los residuos R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ o R¹⁵ sea diferente de hidrógeno, entonces es ventajoso que solo uno de los residuos diferentes de hidrógeno sea diferente de halógeno o metilo. Especialmente si uno de los residuos R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ o R¹⁵ es diferente de hidrógeno, halógeno o metilo, entonces los residuos restantes R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵ se seleccionan entre halógeno e hidrógeno.
- Ejemplos de residuos P son los residuos nombrados a continuación: fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4fluorofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 3-bromofenilo, 4-bromofenilo, 2-trifluorometilfenilo, 25 trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-(metiltio)fenilo, 3-(metiltio)fenilo, 4-(metiltio)fenilo, 2-metoxifenilo, metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 4-nitrofenilo, 4-cianofenilo, 4-terc.-butilfenilo, 4-isopropilfenilo, 3-etoxifenilo, 4-etoxifenilo, 4-n-propoxifenilo, 4-isopropoxifenilo, 3-isopropoxifenilo, 4-n-butoxifenilo, 4-terc.-butoxifenilo, 4-acetilfenilo, 4-acetilfen 4-etoxicarbonilfenilo, metoxicarbonilfenilo. 4-terc.-butoxicarbonilfenilo, 4-(metoxiiminometil)fenilo. (metoximino)etil)fenilo, 2,3-difluorofenilo, 2,4-difluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,3-difluorofenilo, 2,4-trifluorofenilo, 2,3-trifluorofenilo, 3,4-trifluorofenilo, 3,4-trifluor 30 2,3-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 2,5-diclorofe dimetilfenilo, 2,4,5-trimetilfenilo, 2,3-dimetoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 2,4-bis(trifluorometil)fenilo, 3,5-bis(trifluorometil)fenilo, 2-metil-3-metoxifenilo, 2-metil-4-metoxifenilo, 2-metil-6-metoxifenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 35 2-cloro-4-fluorofenilo, 2-cloro-6-fluorofenilo, 4-cloro-2-fluorofenilo, 5-cloro-2-fluorofenil, 4-fluoro-3-metilfenilo, 2-fluorofenilo, 4-fluoro-3-metilfenilo, 2-fluorofenilo, 4-fluoro-3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-fluoro-2-metilfenilo, 2-fluoro-3-metoxifenilo, 2-fluoro-4-metoxifenilo, 2-fluor trifluorometilfenilo, 4-cloro-3-metilfenilo, 2-cloro-4-metilfenilo, 2-cloro-6-metilfenil, 3-cloro-2-metilfenilo, 5-cloro-2metilfenilo, 2-cloro-4-metoxifenilo, 2-cloro-6-metoxifenilo, 2-cloro-4-trifluorometilfenilo, 3-fluoro-4-metilfenilo, 4-fluoro-6-metoxifenilo, 4-fluoro-6-metoxifenilo, 2-cloro-6-metoxifenilo, 2-cloro-6-metoxifenilo, 4-fluoro-6-metoxifenilo, 4-fluo 3-metilfenilo, 3-fluoro-4-metoxifenilo, 3-fluoro-4-etoxifenilo, 3-fluoro-4-trifluorometilfenilo, 3-cloro-4-metilfenilo, 3-fluoro-4-metilfenilo, 3-fluo 40 4-metoxifenilo, 3-cloro-4-etoxifenilo, 3-cloro-4-trifluorometilfenilo, 3-metil-4-metoxifenilo, 4-cloro-2,5-difluorofenilo, 4terc.-butil-2-fluorofenilo, 2-fluoro-4-isopropilfenilo, 4-etoxi-2-fluorofenilo, 4-acetil-2-fluorofenilo, 2-metilfenilo, 3metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo.

Tarticularmente preferible R⁵ en la fórmula I representa fenilo y especialmente un residuo P y en particular uno de los residuos P indicados aquí como ejemplo.

- 45 Según otra forma preferida de realización R⁵ representa alquilo de C₁-C₆ o haloalquilo de C₁-C₆, en particular representa alquilo de C₃-C₆, especialmente n-propilo, isopropilo, terc.-butilo, 1 ,2-dimetilpropilo o 1,2,2-trimetilpropilo, o representa trifluorometilo.
- Según otra forma preferida de realización R⁵ representa heteroarilo de 5 miembros, que además de carbono tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de nitrógeno como átomos de anillo; o representa heteroarilo de 5 miembros que además de carbono tiene 1 heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre y opcionalmente 1, 2 ó 3 átomos de nitrógeno como átomos de anillo, o representa hetarilo de 6 miembros que tiene 1, 2, 3 ó 4 átomos de nitrógeno como átomos de anillo, en cuyo caso el hetarilo de 5 y 6 miembros puede estar sin sustituir o los átomos de hidrógeno en el hetarilo sin sustituir pueden reemplazarse parcial o totalmente por sustituyentes Rª del modo designado arriba, de

manera que el número total de todos los sustituyentes R^a en hetarilo es típicamente de 1, 2, 3 ó 4. Los sustituyentes en átomos de anillo - nitrógeno son en particular residuos R^a enlazados con C y especialmente alquilo de C₁-C₄.

En esta forma de realización R⁵ representa preferentemente 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo o 5-pirimidinilo opcionalmente substituidos, en cuyo caso los residuos heterocíclicos previamente mencionados están preferentemente sin sustituir o tienen 1, 2 ó 3 substituyentes R^a. Respecto de los residuos preferidos y particularmente preferidos es válido lo dicho previamente.

Ejemplos de residuos heteroaromáticos preferidos R⁵ son

5

10

20

25

- 2-Tienilo opcionalmente sustituido, como 2-tienilo sin sustituir, 5-metiltiofen-2-ilo, 4-metiltiofen-2-ilo, 5-clorotiofen-2-ilo, 3-cianotiofen-2-ilo, 5-formiltiofen-2-ilo, 5-acetiltiofen-2-ilo, 5-(metoxiiminometilo)tiofen-2-ilo, 5-(1-(metoxiimino)etil)tiofen-2-ilo, 4-bromtiofen-2-ilo, 3,5-diclorotiofen-2-ilo,
- 3-Tienilo opcionalmente sustituido, como 3-tienilo sin sustituir, 2-metiltiofen-3-ilo, 2,5-diclorotiofen-3-ilo, 2,4,5-tricloro-tiofen-3-ilo,
- 2-Furilo opcionalmente sustituido, como 2-furilo sin sustituir, 5-metilfuran-2-ilo, 5-clorofuran-2-ilo, 4-metilfuran-2-ilo, 3-cianofuran-2-ilo, 5-acetilfuran-2-ilo,
- 15 3-Furilo opcionalmente sustituido, como 3-furilo sin sustituir, 2-metilfuran-3-ilo, 2,5-dimetilfuran-3-ilo,
 - 2-piridilo opcionalmente sustituido, como 2-piridilo sin sustituir, 3-fluoro-piridin-2-ilo, 3-cloro-piridin-2-ilo, 3-bromopiridin-2-ilo, 3-trifluorometil-piridin-2-ilo, 3-metil-piridin-2-ilo, 3-etil-piridin-2-ilo, 3,5-difluoro-piridin-2-ilo, 3,5-dipromo-piridin-2-ilo, 3,5-dimetil-piridin-2-ilo, 3-fluoro-5-trifluorometil-piridin-2-ilo, 3-cloro-5-fluoro-piridin-2-ilo, 3-cloro-5-cloro-piridin-2-ilo, 3-fluoro-5-metil-piridin-2-ilo, 3-metil-5-fluoro-piridin-2-ilo, 3-metil-5-cloro-piridin-2-ilo, 5-metil-piridin-2-ilo, 5-metil-piridin-2-ilo, 5-metil-piridin-2-ilo, 5-metil-piridin-2-ilo, 6-metil-piridin-2-ilo, 5-metil-piridin-2-ilo, 5-metil-piridin-2-ilo, 6-metil-piridin-2-ilo,
 - 3-Piridilo opcionalmente sustituido, como 3-piridilo sin sustituir, 2-cloro-piridin-3-ilo, 2-brom-piridin-3-ilo, 2-metil-piridin-3-ilo, 2,4-dicloro-piridin-3-ilo, 2,4-difluoropiridin-3-ilo, 2-fluoro-4-cloropiridin-3-ilo, 2-cloro-4-fluoro-piridin-3-ilo, 2-metil-4-fluoro-piridin-3-ilo, 2-metil-4-cloro-piridin-3-ilo, 2,4-dimetil-piridin-3-ilo, 2,4,6-tricloropiridin-3-ilo, 2,4,6-tribrompiridin-3-ilo, 2,4,6-trimetil-piridin-3-ilo, 2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 6-cloropiridin-3-ilo,
 - 4-Piridilo opcionalmente sustituido, como 4-piridilo sin sustituir, 3-cloropiridin-4-ilo, 3-bromo-piridin-4-ilo, 3-metil-piridin-4-ilo, 3,5-dicloro-piridin-4-ilo, 3,5-dibromo-piridin-4-ilo, 3,5-dimetil-piridin-4-ilo,
- 4-Pirimidinilo opcionalmente sustituido, como 4-pirimidinilo sin sustituir, 5-cloropirimidin-4-ilo, 5-fluoropirimidin-4-ilo, 5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ilo, 2-metil-6-trifluorometil-pirimidin-4-ilo, 2-metil-6-trifluorometil-pirimidin-4-ilo, 6-trifluorometil-pirimidin-4-ilo, 2-metil-5-fluoro-pirimidin-4-ilo, 2-metil-5-cloro-pirimidin-4-ilo, 2-metil-5-cloro-pirimidin-4-ilo, 5-cloro-6-metil-pirimidin-4-ilo, 5-cloro-6-etil-pirimidin-4-ilo, 5-cloro-6-isopropilpirimidin-4-ilo, 5-bromo-6-metil-pirimidin-4-ilo, 5-fluoro-6-fluorometil-pirimidin-4-ilo, 2,6-dimetil-5-cloro-pirimidin-4-ilo, 5,6-dimetil-pirimidin-4-ilo, 2,5-dimetil-pirimidin-4-ilo, 5-metil-6-metoxi-pirimidin-4-ilo,
- 5-Pirimidinilo opcionalmente sustituido, como 5-pirimidinilo sin sustituir, 4-metil-pirimidin-5-ilo, 4,6-dimetil-pirimidin-5-ilo, 2.4,6-trimetilpirimidin-5-ilo, 4-trifluorometil-6-metil-pirimidin-5-ilo,
 - 2-Pirimidinilo opcionalmente sustituido, como 2-pirimidinilo sin sustituir, 4,6-dimetilpirimidin-2-ilo, 4,5-dimetilpirimidin-2-ilo, 4,6-dimetil-5-cloro-pirimidin-2-ilo.

En particular se prefieren los siguientes grupos de compuestos de la fórmula I:

En particular, en consideración a su uso, se prefieren los compuestos de las fórmulas generales I.1, I.2, I.3, 1.4, I.5, 1.6 y 1.7, nombrados en las siguientes tablas 1 a 9.

5 Tabla 1

Compuestos de las fórmulas I.1, I.2, 1.3, I.4, I.5, I.6 y I.7, en las que R^3 significa hidrógeno y la combinación de R^4 y R^5 para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 2

Compuestos de las fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, 1.6 y I.7, en las que R³ significa metilo y la combinación de R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 3

Compuestos de las fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 y 1.7, en las que R³ significa etilo y la combinación de R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 4

Compuestos de las fórmulas I.1, 1.2, I.3, I.4, I.5, I.6 y 1.7, en las cuales R³ significa metoxi y la combinación de R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 5

5

Compuestos de las fórmulas I.1, 1.2, I.3, I.4, I.5, I.6 y 1.7, en las cuales R³ significa etoxi y la combinación de R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 6

Compuestos de las fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, 1.6 y 1.7 en las cuales R³ significa iso-propilo y la combinación de R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 7

Compuestos de las fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, 1.5, 1.6 y I.7, en las cuales R^3 significa terc.-butilo y la combinación de R^4 y R^5 para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

15 Tabla 8

Compuestos de las fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, 1.6 y 1.7 en las cuales R³ significa trifluorometilo y la combinación de R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla 9

Compuestos de las fórmulas I.1, 1.2, I.3, I.4, I.5, 1.6 y 1.7, en las cuales R^3 significa difluorometoxi y la combinación de R^4 y R^5 para un compuesto corresponde respectivamente a una fila de la tabla A.

Tabla A

No.	R⁴	R ⁵
A-1.	Н	Fenilo
A-2.	Н	2-Fluorofenilo
A-3.	Н	3-Fluorofenilo
A-4.	Н	4-Fluorofenilo
A-5.	Н	2-Clorofenilo
A-6.	Н	3-Clorofenilo
A-7.	Н	4-Clorofenilo
A-8.	Н	3-Bromofenilo
A-9.	Н	4-Bromofenilo
A-10.	Н	2-Trifluorometilofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-11.	Н	3-Trifluorometilofenilo
A-12.	Н	4-Trifluorometilofenilo
A-13.	Н	2-(Metilotio)fenilo
A-14.	Н	3-(Metilotio)fenilo
A-15.	Н	4-(Metilotio)fenilo
A-16.	Н	2-Metoxifenilo
A-17.	Н	3-Metoxifenilo
A-18.	Н	4-Metoxifenilo
A-19.	Н	4-Nitrofenilo
A-20.	Н	4-Cianofenilo
A-21.	Н	4-tercButilofenilo
A-22.	Н	4-Isopropilofenilo
A-23.	Н	3-Etoxifenilo
A-24.	Н	4-Etoxifenilo
A-25.	Н	4-n-Propoxifenilo
A-26.	Н	3-Isopropoxifenilo
A-27.	Н	4-Isopropoxifenilo
A-28.	Н	4-n-Butoxifenilo
A-29.	Н	4-tercButoxifenilo
A-30.	Н	4-(Metoxiiminometilo)fenilo
A-31.	Н	4-(1-(Metoxiimino)etilo)fenilo
A-32.	Н	2,3-Difluorofenilo
A-33.	Н	2,4-Difluorofenilo
A-34.	Н	2,5-Difluorofenilo
A-35.	Н	3,4-Difluorofenilo
A-36.	Н	3,5-Difluorofenilo
A-37.	Н	2,6-Difluorofenilo
A-38.	Н	2,4,6-Trifluorofenilo

No.	R⁴	R ⁵
A-39.	Н	2,4,5-Trifluorofenilo
A-40.	Н	2,3,4-Trifluorofenilo
A-41.	Н	2,3,5-Trifluorofenilo
A-42.	Н	3,4,5-Trifluorofenilo
A-43.	Н	2,3-Diclorofenilo
A-44.	Н	2,5-Diclorofenilo
A-45.	Н	3,5-Diclorofenilo
A-46.	Н	2,6-Diclorofenilo
A-47.	Н	2,3-Dimetilofenilo
A-48.	Н	2,4-Dimetilofenilo
A-49.	Н	2,5-Dimetilofenilo
A-50.	Н	2,4,5-Trimetilofenilo
A-51.	Н	2,3-Dimetoxifenilo
A-52.	Н	2,4-Dimetoxifenilo
A-53.	Н	3,4-Dimetoxifenilo
A-54.	Н	2,4-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-55.	Н	3,5-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-56.	Н	2-Metilo-3-metoxifenilo
A-57.	Н	2-Metilo-4-metoxifenilo
A-58.	Н	2-Metilo-6-metoxifenilo
A-59.	Н	3-Cloro-4-fluorofenilo
A-60.	Н	2-Cloro-4-fluorofenilo
A-61.	Н	2-Cloro-6-fluorofenilo
A-62.	Н	4-Cloro-2-fluorofenilo
A-63.	Н	5-Cloro-2-fluorofenilo
A-64.	Н	4-Fluor-3-metilofenilo
A-65.	Н	2-Fluoro-4-metilofenilo
A-66.	Н	4-Fluoro-2-metilofenilo

	R⁴	R ⁵
A-67.	Н	2-Fluoro-3-metoxifenilo
A-68.	Н	2-Fluoro-4-metoxifenilo
A-69.	Н	2-Fluoro-6-metoxifenilo
A-70.	Н	2-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-71.	Н	4-Cloro-3-metilofenilo
A-72.	Н	2-Cloro-4-metilofenilo
A-73.	Н	2-Cloro-6-metilofenilo
A-74.	Н	5-Cloro-2-metilofenilo
A-75.	Н	3-Cloro-2-metilofenilo
A-76.	Н	2-Cloro-4-metoxifenilo
A-77.	Н	2-Cloro-6-metoxifenilo
A-78.	Н	2-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-79.	Н	3-Fluoro-4-metilofenilo
A-80.	Н	3-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-81.	Н	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-82.	Н	3-Fluoro-4-metoxifenilo
A-83.	Н	3-Fluoro-4-etoxifenilo
A-84.	Н	3-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-85.	Н	3-Cloro-4-metilofenilo
A-86.	Н	3-Cloro-4-metoxifenilo
A-87.	Н	3-Cloro-4-etoxifenilo
A-88.	Н	3-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-89.	Н	3-Metilo-4-metoxifenilo
A-90.	Н	4-Cloro-2,5-difluorofenilo
A-91.	Н	4-tercButilo-2-fluorofenilo
A-92.	Н	2-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-93.	Н	4-Etoxi-2-fluorofenilo
A-94.	Н	4-Acetilo-2-fluorofenilo

No.	R⁴	R ⁵
A-95.	Н	2-Tienilo
A-96.	Н	5-Metilotiofen-2-ilo
A-97.	Н	4-Metilotiofen-2-ilo
A-98.	Н	5-Clorotiofen-2-ilo
A-99.	Н	3-Cianotiofen-2-ilo
A-100.	Н	5-Formilotiofen-2-ilo
A-101.	Н	5-Acetilotiofen-2-ilo
A-102.	Н	5-(Metoxiiminometilo)tiofen-2-ilo
A-103.	Н	5-(1-(Metoxiimino)etilo)tiofen-2-ilo
A-104.	Н	4-Bromotiofen-2-ilo
A-105.	Н	3,5-Diclorotiofen-2-ilo
A-106.	Н	3-Tienilo
A-107.	Н	2-Metilotiofen-3-ilo
A-108.	Н	2,5-Diclorotiofen-3-ilo
A-109.	Н	2,4,5-Tricloro-tiofen-3-ilo
A-110.	Н	2-Furilo
A-111.	Н	5-Metilofuran-2-ilo
A-112.	Н	5-Clorofuran-2-ilo
A-113.	Н	4-Metilofuran-2-ilo
A-114.	Н	3-Cianofuran-2-ilo
A-115.	Н	5-Acetilofuran-2-ilo
A-116.	Н	3-Furilo
A-117.	Н	2-Metilofuran-3-ilo
A-118.	Н	2,5-Dimetilofuran-3-ilo
A-119.	Н	2-Piridilo
A-120.	Н	3-Fluoro-piridin-2-ilo
A-121.	Н	3-Cloro-piridin-2-ilo
A-122.	Н	3-Brompiridin-2-ilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-123.	Н	3-Trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-124.	Н	3-Metilo-piridin-2-ilo
A-125.	Н	3-Etilo-piridin-2-ilo
A-126.	Н	3,5-Difluoro-piridin-2-ilo
A-127.	Н	3,5-Dicloro-piridin-2-ilo
A-128.	Н	3,5-Dibrom-piridin-2-ilo
A-129.	Н	3,5-Dimetilo-piridin-2-ilo
A-130.	Н	3-Fluoro-5-trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-131.	Н	3-Cloro-5-fluoro-piridin-2-ilo
A-132.	Н	3-Cloro-5-metilo-piridin-2-ilo
A-133.	Н	3-Fluoro-5-cloro-piridin-2-ilo
A-134.	Н	3-Fluoro-5-metilo-piridin-2-ilo
A-135.	Н	3-Metilo-5-fluoro-piridin-2-ilo
A-136.	Н	3-Metilo-5-cloro-piridin-2-ilo
A-137.	Н	5-Nitro-piridin-2-ilo
A-138.	Н	5-Ciano-piridin-2-ilo
A-139.	Н	5-Metoxicarbonilo-piridin-2-ilo
A-140.	Н	5-Trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-141.	Н	5-Metilo-piridin-2-ilo
A-142.	Н	4-Metilo-piridin-2-ilo
A-143.	Н	6-Metilo-piridin-2-ilo
A-144.	Н	3-Piridilo
A-145.	Н	2-Cloro-piridin-3-ilo
A-146.	Н	2-Brom-piridin-3-ilo
A-147.	Н	2-Metilo-piridin-3-ilo
A-148.	Н	2,4-Dicloro-piridin-3-ilo
A-149.	Н	2,4-Dibrom-piridin-3-ilo
A-150.	Н	2,4-Difluoropiridin-3-ilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-151.	Н	2-Fluoro-4-cloropiridin-3-ilo
A-152.	Н	2-Cloro-4-fluoro-piridin-3-ilo
A-153.	Н	2-Cloro-4-metilo-piridin-3-ilo
A-154.	Н	2-Metilo-4-fluoro-piridin-3-ilo
A-155.	Н	2-Metilo-4-cloro-piridin-3-ilo
A-156.	Н	2,4-Dimetilo-piridin-3-ilo
A-157.	Н	2,4,6-Tricloropiridin-3-ilo
A-158.	Н	2,4,6-Tribrompiridin-3-ilo
A-159.	Н	2,4,6-Trimetilo-piridin-3-ilo
A-160.	Н	2,4-Dicloro-6-metilopiridin-3-ilo
A-161.	Н	4-Piridilo
A-162.	Н	3-Cloro-piridin-4-ilo
A-163.	Н	3-Brom-piridin-4-ilo
A-164.	Н	3-Metilo-piridin-4-ilo
A-165.	Н	3,5-Dicloro-piridin-4-ilo
A-166.	Н	3,5-Dibrom-piridin-4-ilo
A-167.	Н	3,5-Dimetilo-piridin-4-ilo
A-168.	Н	4-Pirimidinilo
A-169.	Н	5-Cloropirimidin-4-ilo
A-170.	Н	5-Fluoropirimidin-4-ilo
A-171.	Н	5-Fluoro-6-cloropirimidin-4-ilo
A-172.	Н	2-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-173.	Н	2,5-Dimetilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-174.	Н	5-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-175.	Н	6-Trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-176.	Н	2-Metilo-5-fluoro-pirimidin-4-ilo
A-177.	Н	2-Metilo-5-cloro-pirimidin-4-ilo
A-178.	Н	5-Cloro-6-metilo-pirimdin-4-ilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-179.	Н	5-Cloro-6-etilo-pirimdin-4-ilo
A-180.	Н	5-Cloro-6-isopropilo-pirimdin-4-ilo
A-181.	Н	5-Brom-6-metilo-pirimidin-4-ilo
A-182.	Н	5-Fluoro-6-metilo-pirimidin-4-ilo
A-183.	Н	5-Fluoro-6-fluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-184.	Н	2,6-Dimetilo-5-cloro-pirimdin-4-ilo
A-185.	Н	5,6-Dimetilo-pirimidin-4-ilo
A-186.	Н	2,5-Dimetilo-pirimidin-4-ilo
A-187.	Н	2,5,6-Trimetilo-pirimidin-4-ilo
A-188.	Н	5-Metilo-6-metoxi-pirimidin-4-ilo
A-189.	Н	5-Pirimidinilo
A-190.	Н	4-Metilo-pirimidin-5-ilo
A-191.	Н	4,6-Dimetilo-pirimidin-5-ilo
A-192.	Н	2,4,6-Trimetilopirimidin-5-ilo
A-193.	Н	4-Trifluorometilo-6-metilo-pirimidin-5-ilo
A-194.	Н	2-Pirimidinilo
A-195.	Н	4,6-Dimetilopirimidin-2-ilo
A-196.	Н	4,5,6-Trimetilopirimidin-2-ilo
A-197.	Н	4,6-Ditrifluorometilo-pirimidin-2-ilo
A-198.	Н	4,6-Dimetilo-5-cloro-pirimidin-2-ilo
A-199.	CH ₃	Fenilo
A-200.	CH ₃	2-Fluorofenilo
A-201.	CH₃	3-Fluorofenilo
A-202.	CH₃	4-Fluorofenilo
A-203.	CH₃	2-Clorofenilo
A-204.	CH₃	3-Clorofenilo
A-205.	CH₃	4-Clorofenilo
A-206.	CH₃	3-Bromfenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-207.	CH ₃	4-Bromfenilo
A-208.	CH ₃	2-Trifluorometilofenilo
A-209.	CH ₃	3-Trifluorometilofenilo
A-210.	CH ₃	4-Trifluorometilofenilo
A-211.	CH ₃	2-(Metilotio)fenilo
A-212.	CH ₃	3-(Metilotio)fenilo
A-213.	CH ₃	4-(Metilotio)fenilo
A-214.	CH ₃	2-Metoxifenilo
A-215.	CH ₃	3-Metoxifenilo
A-216.	CH ₃	4-Metoxifenilo
A-217.	CH ₃	4-Nitrofenilo
A-218.	CH₃	4-Cianofenilo
A-219.	CH₃	4-tercButilofenilo
A-220.	CH ₃	4-Isopropilofenilo
A-221.	CH ₃	3-Etoxifenilo
A-222.	CH ₃	4-Etoxifenilo
A-223.	CH ₃	4-n-Propoxifenilo
A-224.	CH ₃	3-Isopropoxifenilo
A-225.	CH ₃	4-Isopropoxifenilo
A-226.	CH ₃	4-n-Butoxifenilo
A-227.	CH ₃	4-tertButoxifenilo
A-228.	CH ₃	4-(Metoxiiminometilo)fenilo
A-229.	CH ₃	4-(1-(Metoxiimino)etilo)fenilo
A-230.	CH ₃	2,3-Difluorofenilo
A-231.	CH ₃	2,4-Difluorofenilo
A-232.	CH ₃	2,5-Difluorofenilo
A-233.	CH ₃	3,4-Difluorofenilo
A-234.	CH ₃	3,5-Difluorofenilo

No.	R⁴	R ⁵
A-236.	CH ₃	2,4,6-Trifluorofenilo
A-237.	CH ₃	2,4,5-Trifluorofenilo
A-238.	CH ₃	2,3,4-Trifluorofenilo
A-239.	CH ₃	2,3,5-Trifluorofenilo
A-240.	CH ₃	3,4,5-Trifluorofenilo
A-241.	CH ₃	2,3-Diclorofenilo
A-242.	CH ₃	2,5-Diclorofenilo
A-243.	CH ₃	3,5-Diclorofenilo
A-244.	CH ₃	2,6-Diclorofenilo
A-245.	CH ₃	2,3-Dimetilofenilo
A-246.	CH ₃	2,4-Dimetilofenilo
A-247.	CH ₃	2,5-Dimetilofenilo
A-248.	CH ₃	2,4,5-Trimetilofenilo
A-249.	CH ₃	2,3-Dimetoxifenilo
A-250.	CH ₃	2,4-Dimetoxifenilo
A-251.	CH ₃	3,4-Dimetoxifenilo
A-252.	CH ₃	2,4-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-253.	CH ₃	3,5-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-254.	CH ₃	2-Metilo-3-metoxifenilo
A-255.	CH ₃	2-Metilo-4-metoxifenilo
A-256.	CH ₃	2-Metilo-6-metoxifenilo
A-257.	CH ₃	3-Cloro-4-fluorofenilo
A-258.	CH ₃	2-Cloro-4-fluorofenilo
A-259.	CH ₃	2-Cloro-6-fluorofenilo
A-260.	CH ₃	4-Cloro-2-fluorofenilo
A-261.	CH ₃	5-Cloro-2-fluorofenilo
A-262.	CH ₃	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-263.	CH ₃	2-Fluoro-4-metilofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-264.	CH ₃	4-Fluoro-2-metilofenilo
A-265.	CH ₃	2-Fluoro-3-metoxifenilo
A-266.	CH ₃	2-Fluoro-4-metoxifenilo
A-267.	CH ₃	2-Fluoro-6-metoxifenilo
A-268.	CH ₃	2-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-269.	CH ₃	4-Cloro-3-metilofenilo
A-270.	CH ₃	2-Cloro-4-metilofenilo
A-271.	CH ₃	2-Cloro-6-metilofenilo
A-272.	CH ₃	5-Cloro-2-metilofenilo
A-273.	CH ₃	3- Cloro-2-metilofenilo
A-274.	CH ₃	2-Cloro-4-metoxifenilo
A-275.	CH ₃	2-Cloro-6-metoxifenilo
A-276.	CH ₃	2-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-277.	CH ₃	3-Fluoro-4-metilofenilo
A-278.	CH ₃	3-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-279.	CH ₃	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-280.	CH ₃	3-Fluoro-4-metoxifenilo
A-281.	CH ₃	3-Fluoro-4-etoxifenilo
A-282.	CH ₃	3-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-283.	CH ₃	3-Cloro-4-metilofenilo
A-284.	CH ₃	3-Cloro-4-metoxifenilo
A-285.	CH ₃	3-Cloro-4-etoxifenilo
A-286.	CH ₃	3-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-287.	CH ₃	3-Metilo-4-metoxifenilo
A-288.	CH ₃	4-Cloro-2,5-difluorofenilo
A-289.	CH ₃	4-tertButilo-2-fluorofenilo
A-290.	CH ₃	2-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-291.	CH ₃	4-Etoxi-2-fluorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-292.	CH ₃	4-Acetilo-2-fluorofenilo
A-293.	CH ₃	2-Tienilo
A-294.	CH ₃	5-Metilotiofen-2-ilo
A-295.	OCH ₃	4-Metilotiofen-2-ilo
A-296.	CH ₃	5-Clorotiofen-2-ilo
A-297.	CH ₃	3-Cianotiofen-2-ilo
A-298.	CH ₃	5-Formilotiofen-2-ilo
A-299.	CH ₃	5-Acetilotiofen-2-ilo
A-300.	CH ₃	5-(Metoxiiminometilo)tiofen-2-ilo
A-301.	CH ₃	5-(1-(Metoxiimino)etilo)tiofen-2-ilo
A-302.	CH ₃	4-Bromotiofen-2-ilo
A-303.	CH ₃	3,5-Diclorotiofen-2-ilo
A-304.	CH ₃	3-Tienilo
A-305.	CH ₃	2-Metilotiofen-3-ilo
A-306.	CH ₃	2,5-Diclorotiofen-3-ilo
A-307.	CH ₃	2,4,5-Tricloro-tiofen-3-ilo
A-308.	CH ₃	2-Furilo
A-309.	CH ₃	5-Metilofuran-2-ilo
A-310.	CH ₃	5-Clorofuran-2-ilo
A-311.	CH ₃	4-Metilofuran-2-ilo
A-312.	CH ₃	3-Cianofuran-2-ilo
A-313.	CH ₃	5-Acetilofuran-2-ilo
A-314.	CH ₃	3-Furilo
A-315.	CH ₃	2-Metilofuran-3-ilo
A-316.	CH ₃	2,5-Dimetilofuran-3-ilo
A-317.	CH ₃	2-Piridilo
A-318.	CH ₃	3-Fluoro-piridin-2-ilo
A-319.	CH ₃	3-Cloro-piridin-2-ilo

No.	R⁴	R ⁵
A-320.	CH ₃	3-Bromopiridin-2-ilo
A-321.	CH ₃	3-Trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-322.	CH ₃	3-Metilo-piridin-2-ilo
A-323.	CH ₃	3-Etilo-piridin-2-ilo
A-324.	CH ₃	3,5-Difluoro-piridin-2-ilo
A-325.	CH ₃	3,5-Dicloro-piridin-2-ilo
A-326.	CH ₃	3,5-Dibromo-piridin-2-ilo
A-327.	CH ₃	3,5-Dimetilo-piridin-2-ilo
A-328.	CH ₃	3-Fluoro-5-trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-329.	CH ₃	3-Cloro-5-fluoro-piridin-2-ilo
A-330.	CH ₃	3-Cloro-5-metilo-piridin-2-ilo
A-331.	CH ₃	3-Fluoro-5-cloro-piridin-2-ilo
A-332.	CH ₃	3-Fluoro-5-metilo-piridin-2-ilo
A-333.	CH ₃	3-Metilo-5-fluoro-piridin-2-ilo
A-334.	CH ₃	3-Metilo-5-cloro-piridin-2-ilo
A-335.	CH ₃	5-Nitro-piridin-2-ilo
A-336.	CH ₃	5-Ciano-piridin-2-ilo
A-337.	CH ₃	5-Metoxicarbonilo-piridin-2-ilo
A-338.	CH ₃	5-Trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-339.	CH ₃	5-Metilo-piridin-2-ilo
A-340.	CH ₃	4-Metilo-piridin-2-ilo
A-341.	CH ₃	6-Metilo-piridin-2-ilo
A-342.	CH ₃	3-Piridilo
A-343.	CH ₃	2-Cloro-piridin-3-ilo
A-344.	CH ₃	2-Bromo-piridin-3-ilo
A-345.	CH ₃	2-Metilo-piridin-3-ilo
A-346.	CH ₃	2,4-Dicloro-piridin-3-ilo
A-347.	CH ₃	2,4-Dibromo-piridin-3-ilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-348.	CH ₃	2,4-Difluorpiridin-3-ilo
A-349.	CH ₃	2-Fluoro-4-cloropiridin-3-ilo
A-350.	CH ₃	2-Cloro-4-fluoro-piridin-3-ilo
A-351.	CH ₃	2-Cloro-4-metilo-piridin-3-ilo
A-352.	CH ₃	2-Metilo-4-fluoro-piridin-3-ilo
A-353.	CH ₃	2-Metilo-4-cloro-piridin-3-ilo
A-354.	CH ₃	2,4-Dimetilo-piridin-3-ilo
A-355.	CH ₃	2,4,6-Tricloropiridin-3-ilo
A-356.	CH ₃	2,4,6-Tribrompiridin-3-ilo
A-357.	CH ₃	2,4,6-Trimetilo-piridin-3-ilo
A-358.	CH ₃	2,4-Dicloro-6-metilopiridin-3-ilo
A-359.	CH ₃	4-Piridilo
A-360.	CH ₃	3-Cloro-piridin-4-ilo
A-361.	CH ₃	3-Bromo-piridin-4-ilo
A-362.	CH₃	3-Metilo-piridin-4-ilo
A-363.	CH ₃	3,5-Dicloro-piridin-4-ilo
A-364.	CH ₃	3,5-Dibromo-piridin-4-ilo
A-365.	CH ₃	3,5-Dimetilo-piridin-4-ilo
A-366.	CH ₃	4-Pirimidinilo
A-367.	CH ₃	5-Cloropirimidin-4-ilo
A-368.	CH ₃	5-Fluorpirimidin-4-ilo
A-369.	CH ₃	5-Fluoro-6-cloropirimidin-4-ilo
A-370.	CH ₃	2-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-371.	CH ₃	2,5-Dimetilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-372.	CH ₃	5-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-373.	CH ₃	6-Trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-374.	CH ₃	2-Metilo-5-fluoro-pirimidin-4-ilo
A-375.	CH ₃	2-Metilo-5-cloro-pirimidin-4-ilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-376.	CH ₃	5-Cloro-6-metilo-pirimdin-4-ilo
A-377.	CH ₃	5-Cloro-6-etilo-pirimdin-4-ilo
A-378.	CH ₃	5-Cloro-6-isopropilo-pirimidin-4-ilo
A-379.	CH ₃	5-Bromo-6-metilo-pirimidin-4-ilo
A-380.	CH ₃	5-Fluoro-6-metilo-pirimidin-4-ilo
A-381.	CH ₃	5-Fluoro-6-fluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-382.	CH ₃	2,6-Dimetilo-5-cloro-pirimdin-4-ilo
A-383.	CH ₃	5,6-Dimetilo-pirimidin-4-ilo
A-384.	CH ₃	2,5-Dimetilo-pirimidin-4-ilo
A-385.	CH ₃	2,5,6-Trimetilo-pirimidin-4-ilo
A-386.	CH ₃	5-Metilo-6-metoxi-pirimidin-4-ilo
A-387.	CH ₃	5-Pirimidinilo
A-388.	CH ₃	4-Metilo-pirimidin-5-ilo
A-389.	CH ₃	4,6-Dimetilo-pirimidin-5-ilo
A-390.	CH ₃	2,4,6-Trimetilopirimidin-5-ilo
A-391.	CH ₃	4-Trifluorometilo-6-metilo-pirimidin-5-ilo
A-392.	CH ₃	2-Pirimidinilo
A-393.	CH ₃	4,6-Dimetilopirimidin-2-ilo
A-394.	CH ₃	4,5,6-Trimetilopirimidin-2-ilo
A-395.	CH ₃	4,6-Ditrifluorometilo-pirimidin-2-ilo
A-396.	CH ₃	4,6-Dimetilo-5-cloro-pirimidin-2-ilo
A-397.	CF ₃	Fenilo
A-398.	CF ₃	2-Fluorofenilo
A-399.	CF ₃	3-Fluorofenilo
A-400.	CF ₃	4-Fluorofenilo
A-401.	CF ₃	2-Clorofenilo
A-402.	CF ₃	3-Clorofenilo
A-403.	CF ₃	4-Clorofenilo

No.	R⁴	R ⁵
A-404.	CF ₃	3-Bromofenilo
A-405.	CF ₃	4-Bromofenilo
A-406.	CF ₃	2-Trifluorometilofenilo
A-407.	CF ₃	3-Trifluorometilofenilo
A-408.	CF ₃	4-Trifluorometilofenilo
A-409.	CF ₃	2-(Metilotio)fenilo
A-410.	CF ₃	3-(Metilotio)fenilo
A-411.	CF ₃	4-(Metilotio)fenilo
A-412.	CF ₃	2-Metoxifenilo
A-413.	CF ₃	3-Metoxifenilo
A-414.	CF ₃	4-Metoxifenilo
A-415.	CF ₃	4-Nitrofenilo
A-416.	CF ₃	4-Cianofenilo
A-417.	CF ₃	4-tercButilofenilo
A-418.	CF ₃	4-Isopropilofenilo
A-419.	CF ₃	3-Etoxifenilo
A-420.	CF ₃	4-Etoxifenilo
A-421.	CF ₃	4-n-Propoxifenilo
A-422.	CF ₃	3-Isopropoxifenilo
A-423.	CF ₃	4-Isopropoxifenilo
A-424.	CF ₃	4-n-Butoxifenilo
A-425.	CF ₃	4-tercButoxifenilo
A-426.	CF ₃	4-(Metoxiiminometilo)fenilo
A-427.	CF ₃	4-(1-(Metoxiimino)etilo)fenilo
A-428.	CF ₃	2,3-Difluorofenilo
A-429.	CF ₃	2,4-Difluorofenilo
A-430.	CF ₃	2,5-Difluorofenilo
A-431.	CF ₃	3,4-Difluorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-432.	CF ₃	3,5-Difluorofenilo
A-433.	CF ₃	2,6-Difluorofenilo
A-434.	CF ₃	2,4,6-Trifluorofenilo
A-435.	CF ₃	2,4,5-Trifluorofenilo
A-436.	CF ₃	2,3,4-Trifluorofenilo
A-437.	CF ₃	2,3,5-Trifluorofenilo
A-438.	CF ₃	3,4,5-Trifluorofenilo
A-439.	CF ₃	2,3-Diclorofenilo
A-440.	CF ₃	2,5-Diclorofenilo
A-441.	CF ₃	3,5-Diclorofenilo
A-442.	CF ₃	2,6-Diclorofenilo
A-443.	CF ₃	2,3-Dimetilofenilo
A-444.	CF ₃	2,4-Dimetilofenilo
A-445.	CF ₃	2,5-Dimetilofenilo
A-446.	CF ₃	2,4,5-Trimetilofenilo
A-447.	CF ₃	2,3-Dimetoxifenilo
A-448.	CF ₃	2,4-Dimetoxifenilo
A-449.	CF ₃	3,4-Dimetoxifenilo
A-450.	CF ₃	2,4-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-451.	CF ₃	3,5-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-452.	CF ₃	2-Metilo-3-metoxifenilo
A-453.	CF ₃	2-Metilo-4-metoxifenilo
A-454.	CF ₃	2-Metilo-6-metoxifenilo
A-455.	CF ₃	3-Cloro-4-fluorofenilo
A-456.	CF ₃	2-Cloro-4-fluorofenilo
A-457.	CF ₃	2-Cloro-6-fluorofenilo
A-458.	CF ₃	4-Cloro-2-fluorofenilo
A-459.	CF ₃	5-Cloro-2-fluorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-460.	CF ₃	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-461.	CF ₃	2-Fluoro-4-metilofenilo
A-462.	CF ₃	4-Fluoro-2-metilofenilo
A-463.	CF ₃	2-Fluoro-3-metoxifenilo
A-464.	CF ₃	2-Fluoro-4-metoxifenilo
A-465.	CF ₃	2-Fluoro-6-metoxifenilo
A-466.	CF ₃	2-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-467.	CF ₃	4-Cloro-3-metilofenilo
A-468.	CF ₃	2-Cloro-4-metilofenilo
A-469.	CF ₃	2-Cloro-6-metilofenilo
A-470.	CF ₃	5-Cloro-2-metilofenilo
A-471.	CF ₃	3-Cloro-2-metilofenilo
A-472.	CF ₃	2-Cloro-4-metoxifenilo
A-473.	CF ₃	2-Cloro-6-metoxifenilo
A-474.	CF ₃	2-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-475.	CF ₃	3-Fluoro-4-metilofenilo
A-476.	CF ₃	3-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-477.	CF ₃	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-478.	CF ₃	3-Fluoro-4-metoxifenilo
A-479.	CF ₃	3-Fluoro-4-etoxifenilo
A-480.	CF ₃	3-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-481.	CF ₃	3-Cloro-4-metilofenilo
A-482.	CF ₃	3-Cloro-4-metoxifenilo
A-483.	CF ₃	3-Cloro-4-etoxifenilo
A-484.	CF ₃	3-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-485.	CF ₃	3-Metilo-4-metoxifenilo
A-486.	CF ₃	4-Cloro-2,5-difluorofenilo
A-487.	CF ₃	4-tertButilo-2-fluorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-488.	CF ₃	2-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-489.	CF ₃	4-Etoxi-2-fluorofenilo
A-490.	CF ₃	4-Acetilo-2-fluorofenilo
A-491.	CF ₃	2-Tienilo
A-492.	CF ₃	5-Metilotiofen-2-ilo
A-493.	CF ₃	4-Metilotiofen-2-ilo
A-494.	CF ₃	5-Clorotiofen-2-ilo
A-495.	CF ₃	3-Cianotiofen-2-ilo
A-496.	CF ₃	5-Formilotiofen-2-ilo
A-497.	CF ₃	5-Acetilotiofen-2-ilo
A-498.	CF ₃	5-(Metoxiiminometilo)tiofen-2-ilo
A-499.	CF ₃	5-(1-(Metoxiimino)etilo)tiofen-2-ilo
A-500.	CF ₃	4-Bromtiofen-2-ilo
A-501	CF ₃	3,5-Diclorotiofen-2-ilo
A-502.	CF ₃	3-Tienilo
A-503.	CF ₃	2-Metilotiofen-3-ilo
A-504.	CF ₃	2,5-Diclorotiofen-3-ilo
A-505.	CF ₃	2,4,5-Tricloro-tiofen-3-ilo
A-506.	CF ₃	2-Furilo
A-507.	CF ₃	5-Metilofuran-2-ilo
A-508.	CF ₃	5-Clorofuran-2-ilo
A-509.	CF ₃	4-Metilofuran-2-ilo
A-510.	CF ₃	3-Cianofuran-2-ilo
A-511.	CF ₃	5-Acetilofuran-2-ilo
A-512.	CF ₃	3-Furilo
A-513.	CF ₃	2-Metilofuran-3-ilo
A-514.	CF ₃	2,5-Dimetilofuran-3-ilo
A-515.	CF ₃	2-Piridilo

No.	R⁴	R ⁵
A-516.	CF ₃	3-Fluoro-piridin-2-ilo
A-517.	CF ₃	3-Cloro-piridin-2-ilo
A-518.	CF ₃	3-Brompiridin-2-ilo
A-519.	CF ₃	3-Trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-520.	CF ₃	3-Metilo-piridin-2-ilo
A-521.	CF ₃	3-Etilo-piridin-2-ilo
A-522.	CF ₃	3,5-Difluoro-piridin-2-ilo
A-523.	CF ₃	3,5-Dicloro-piridin-2-ilo
A-524.	CF ₃	3,5-Dibromo-piridin-2-ilo
A-525.	CF ₃	3,5-Dimetilo-piridin-2-ilo
A-526.	CF ₃	3-Fluoro-5-trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-527.	CF ₃	3-Cloro-5-fluoro-piridin-2-ilo
A-528.	CF ₃	3-Cloro-5-metilo-piridin-2-ilo
A-529.	CF ₃	3-Fluoro-5-cloro-piridin-2-ilo
A-530.	CF ₃	3-Fluoro-5-metilo-piridin-2-ilo
A-531.	CF ₃	3-Metilo-5-fluoro-piridin-2-ilo
A-532.	CF ₃	3-Metilo-5-cloro-piridin-2-ilo
A-533.	CF ₃	5-Nitro-piridin-2-ilo
A-534.	CF ₃	5-Ciano-piridin-2-ilo
A-535.	CF ₃	5-Metoxicarbonilo-piridin-2-ilo
A-536.	CF ₃	5-Trifluorometilo-piridin-2-ilo
A-537.	CF ₃	5-Metilo-piridin-2-ilo
A-538.	CF ₃	4-Metilo-piridin-2-ilo
A-539.	CF ₃	6-Metilo-piridin-2-ilo
A-540.	CF ₃	3-Piridilo
A-541.	CF ₃	2-Cloro-piridin-3-ilo
A-542.	CF ₃	2-Bromo-piridin-3-ilo
A-543.	CF ₃	2-Metilo-piridin-3-ilo
	l .	

No.	R⁴	R ⁵
A-544.	CF ₃	2,4-Dicloro-piridin-3-ilo
A-545.	CF ₃	2,4-Dibromo-piridin-3-ilo
A-546.	CF ₃	2,4-Difluorpiridin-3-ilo
A-547.	CF ₃	2-Fluoro-4-cloropiridin-3-ilo
A-548.	CF ₃	2-Cloro-4-fluoro-piridin-3-ilo
A-549.	CF ₃	2-Cloro-4-metilo-piridin-3-ilo
A-550.	CF ₃	2-Metilo-4-fluoro-piridin-3-ilo
A-551.	CF ₃	2-Metilo-4-chior-piridin-3-ilo
A-552.	CF ₃	2,4-Dimetilo-piridin-3-ilo
A-553.	CF ₃	2,4,6-Tricloropiridin-3-ilo
A-554.	CF ₃	2,4,6-Tribrompiridin-3-ilo
A-555.	CF ₃	2,4,6-Trimetilo-piridin-3-ilo
A-556.	CF ₃	2,4-Dicloro-6-metilopiridin-3-ilo
A-557.	CF ₃	4-Piridilo
A-558.	CF ₃	3-Cloro-piridin-4-ilo
A-559.	CF ₃	3-Bromo-piridin-4-ilo
A-560.	CF ₃	3-Metilo-piridin-4-ilo
A-561.	CF ₃	3,5-Dicloro-piridin-4-ilo
A-562.	CF ₃	3,5-Dibromo-piridin-4-ilo
A-563.	CF ₃	3,5-Dimetilo-piridin-4-ilo
A-564.	CF ₃	4-Pirimidinilo
A-565.	CF ₃	5-Cloropirimidin-4-ilo
A-566.	CF ₃	5-Fluorpirimidin-4-ilo
A-567.	CF ₃	5-Fluoro-6-cloropirimidin-4-ilo
A-568.	CF ₃	2-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-569.	CF ₃	2,5-Dimetilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-570.	CF ₃	5-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-571.	CF ₃	6-Trifluorometilo-pirimidin-4-ilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-572.	CF ₃	2-Metilo-5-fluoro-pirimidin-4-ilo
A-573.	CF ₃	2-Metilo-5-cloro-pirimidin-4-ilo
A-574.	CF ₃	5-Cloro-6-metilo-pirimdin-4-ilo
A-575.	CF ₃	5-Cloro-6-etilo-pirimdin-4-ilo
A-576.	CF ₃	5-Cloro-6-isopropilo-pirimdin-4-ilo
A-577.	CF ₃	5-Bromo-6-metilo-pirimidin-4-ilo
A-578.	CF ₃	5-Fluoro-6-metilo-pirimidin-4-ilo
A-579.	CF ₃	5-Fluoro-6-fluorometilo-pirimidin-4-ilo
A-580.	CF ₃	2,6-Dimetilo-5-cloro-pirimdin-4-ilo
A-581.	CF ₃	5,6-Dimetilo-pirimidin-4-ilo
A-582.	CF ₃	2,5-Dimetilo-pirimidin-4-ilo
A-583.	CF ₃	2,5,6-Trimetilo-pirimidin-4-ilo
A-584.	CF ₃	5-Metilo-6-metoxi-pirimidin-4-ilo
A-585.	CF ₃	5-Pirimidinilo
A-586.	CF ₃	4-Metilo-pirimidin-5-ilo
A-587.	CF ₃	4,6-Dimetilo-pirimidin-5-ilo
A-588.	CF ₃	2,4,6-Trimetilopirimidin-5-ilo
A-589.	CF ₃	4-Trifluorometilo-6-metilo-pirimidin-5-ilo
A-590.	CF ₃	2-Pirimidinilo
A-591.	CF ₃	4,6-Dimetilopirimidin-2-ilo
A-592.	CF ₃	4,5,6-Trimetilopirimidin-2-ilo
A-593.	CF ₃	4,6-Ditrifluorometilo-pirimidin-2-ilo
A-594.	CF ₃	4,6-Dimetilo-5-cloro-pirimidin-2-ilo
A-595.	OCH₃	Fenilo
A-596.	OCH ₃	2-Fluorofenilo
A-597.	OCH₃	3-Fluorofenilo
A-598.	OCH ₃	4-Fluorofenilo
A-599.	OCH ₃	2-Clorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-600.	OCH ₃	3-Clorofenilo
A-601.	OCH ₃	4-Clorofenilo
A-602.	OCH ₃	3-Bromofenilo
A-603.	OCH ₃	4-Bromofenilo
A-604.	OCH₃	2-Trifluorometilofenilo
A-605.	OCH ₃	3-Trifluorometilofenilo
A-606.	OCH ₃	4-Trifluorometilofenilo
A-607.	OCH ₃	2-(Metilotio)fenilo
A-608.	OCH₃	3-(Metilotio)fenilo
A-609.	OCH ₃	4-(Metilotio)fenilo
A-610.	OCH ₃	2-Metoxifenilo
A-611.	OCH ₃	3-Metoxifenilo
A-612.	OCH ₃	4-Metoxifenilo
A-613.	OCH ₃	4-Nitrofenilo
A-614.	OCH ₃	4-Cianofenilo
A-615.	OCH ₃	4-tertButilofenilo
A-616.	OCH ₃	4-Isopropilofenilo
A-617.	OCH ₃	3-Etoxifenilo
A-618.	OCH ₃	4-Etoxifenilo
A-619.	OCH ₃	4-n-Propoxifenilo
A-620.	OCH ₃	3-Isopropoxifenilo
A-621.	OCH ₃	4-Isopropoxifenilo
A-622.	OCH ₃	4-n-Butoxifenilo
A-623.	OCH ₃	4-tercButoxifenilo
A-624.	OCH ₃	4-(Metoxiiminometilo)fenilo
A-625.	OCH ₃	4-(1-(Metoxiimino)etilo)fenilo
A-626.	OCH ₃	2,3-Difluorofenilo
A-627.	OCH ₃	2,4-Difluorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-628.	OCH ₃	2,5-Difluorofenilo
A-629.	OCH ₃	3,4-Difluorofenilo
A-630.	OCH ₃	3,5-Difluorofenilo
A-631.	OCH ₃	2,6-Difluorofenilo
A-632.	OCH ₃	2,4,6-Trifluorofenilo
A-633.	OCH₃	2,4,5-Trifluorofenilo
A-634.	OCH ₃	2,3,4-Trifluorofenilo
A-635.	OCH₃	2,3,5-Trifluorofenilo
A-636.	OCH₃	3,4,5-Trifluorofenilo
A-637.	OCH₃	2,3-Diclorofenilo
A-638.	OCH₃	2,5-Diclorofenilo
A-639.	OCH₃	3,5-Diclorofenilo
A-640.	OCH₃	2,6-Diclorofenilo
A-641.	OCH₃	2,3-Dimetilofenilo
A-642.	OCH₃	2,4-Dimetilofenilo
A-643.	OCH₃	2,5-Dimetilofenilo
A-644.	OCH₃	2,4,5-Trimetilofenilo
A-645.	OCH ₃	2,3-Dimetoxifenilo
A-646.	OCH₃	2,4-Dimetoxifenilo
A-647.	OCH₃	3,4-Dimetoxifenilo
A-648.	OCH₃	2,4-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-649.	OCH₃	3,5-Bis(trifluorometilo)fenilo
A-650.	OCH ₃	2-Metilo-3-metoxifenilo
A-651.	OCH ₃	2-Metilo-4-metoxifenilo
A-652.	OCH ₃	2-Metilo-6-metoxifenilo
A-653.	OCH ₃	3-Cloro-4-fluorofenilo
A-654.	OCH ₃	2-Cloro-4-fluorofenilo
A-655.	OCH ₃	2-Cloro-6-fluorofenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-656.	OCH ₃	4-Cloro-2-fluorofenilo
A-657.	OCH₃	5-Cloro-2-fluorofenilo
A-658.	OCH ₃	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-659.	OCH ₃	2-Fluoro-4-metilofenilo
A-660.	OCH ₃	4-Fluoro-2-metilofenilo
A-661.	OCH ₃	2-Fluoro-3-metoxifenilo
A-662.	OCH ₃	2-Fluoro-4-metoxifenilo
A-663.	OCH ₃	2-Fluoro-6-metoxifenilo
A-664.	OCH₃	2-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-665.	OCH ₃	4-Cloro-3-metilofenilo
A-666.	OCH ₃	2-Cloro-4-metilofenilo
A-667.	OCH ₃	2-Cloro-6-metilofenilo
A-668.	OCH₃	5-Cloro-2-metilofenilo
A-669.	OCH ₃	3-Cloro-2-metilofenilo
A-670.	OCH ₃	2-Cloro-4-metoxifenilo
A-671.	OCH ₃	2-Cloro-6-metoxifenilo
A-672.	OCH ₃	2-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-673.	OCH ₃	3-Fluoro-4-metilofenilo
A-674.	OCH ₃	3-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-675.	OCH ₃	4-Fluoro-3-metilofenilo
A-676.	OCH ₃	3-Fluoro-4-metoxifenilo
A-677.	OCH ₃	3-Fluoro-4-etoxifenilo
A-678.	OCH₃	3-Fluoro-4-trifluorometilofenilo
A-679.	OCH₃	3-Cloro-4-metilofenilo
A-680.	OCH ₃	3-Cloro-4-metoxifenilo
A-681.	OCH ₃	3-Cloro-4-etoxifenilo
A-682.	OCH ₃	3-Cloro-4-trifluorometilofenilo
A-683.	OCH ₃	3-Metilo-4-metoxifenilo

No.	R ⁴	R ⁵
A-684.	OCH ₃	4-Cloro-2,5-difluorofenilo
A-685.	OCH ₃	4-tercButilo-2-fluorofenilo
A-686.	OCH ₃	2-Fluoro-4-isopropilofenilo
A-687.	OCH ₃	4-Etoxi-2-fluorofenilo
A-688.	OCH ₃	4-Acetilo-2-fluorofenilo
A-689.	OCH₃	2-Tienilo
A-690.	OCH ₃	5-Metilotiofen-2-ilo
A-691.	OCH₃	4-Metilotiofen-2-ilo
A-692.	OCH₃	5-Clorotiofen-2-ilo
A-693.	OCH ₃	3-Cianotiofen-2-ilo
A-694.	OCH₃	5-Formilotiofen-2-ilo
A-695.	OCH₃	5-Acetilotiofen-2-ilo
A-696.	OCH₃	5-(Metoxiiminometilo)tiofen-2-ilo
A-697.	OCH₃	5-(1-(Metoxiimino)etilo)tiofen-2-ilo
A-698.	OCH ₃	4-Bromtiofen-2-ilo
A-699.	OCH₃	3,5-Diclorotiofen-2-ilo
A-700.	OCH ₃	3-Tienilo
A-701.	OCH ₃	2-Metilotiofen-3-ilo
A-702.	OCH ₃	2,5-Diclorotiofen-3-ilo
A-703.	OCH ₃	2,4,5-Tricloro-tiofen-3-ilo
A-704.	OCH ₃	2-Furilo
A-705.	OCH ₃	5-Metilofuran-2-ilo
A-706.	OCH ₃	5-Clorofuran-2-ilo
A-707.	OCH ₃	4-Metilofuran-2-ilo
A-708.	OCH ₃	3-Cianofuran-2-ilo
A-709.	OCH ₃	5-Acetilofuran-2-ilo
A-710.	OCH ₃	3-Furilo
A-711.	OCH ₃	2-Metilofuran-3-ilo

No.	R ⁴	R ⁵			
A-712.	OCH ₃	2,5-Dimetilofuran-3-ilo			
A-713.	OCH₃	2-Piridilo			
A-714.	OCH ₃	3-Fluoro-piridin-2-ilo			
A-715.	OCH₃	3-Cloro-piridin-2-ilo			
A-716.	OCH ₃	3-Brompiridin-2-ilo			
A-717.	OCH ₃	3-Trifluorometilo-piridin-2-ilo			
A-718.	OCH₃	3-Metilo-piridin-2-ilo			
A-719.	OCH₃	3-Etilo-piridin-2-ilo			
A-720.	OCH ₃	3,5-Difluoro-piridin-2-ilo			
A-721.	OCH ₃	3,5-Dicloro-piridin-2-ilo			
A-722.	OCH ₃	3,5-Dibromo-piridin-2-ilo			
A-723.	OCH₃	3,5-Dimetilo-piridin-2-ilo			
A-724.	OCH₃	3-Fluoro-5-trifluorometilo-piridin-2-ilo			
A-725.	OCH₃	3-Cloro-5-fluoro-piridin-2-ilo			
A-726.	OCH₃	3-Cloro-5-metilo-piridin-2-ilo			
A-727.	OCH₃	3-Fluoro-5-cloro-piridin-2-ilo			
A-728.	OCH ₃	3-Fluoro-5-metilo-piridin-2-ilo			
A-729.	OCH ₃	3-Metilo-5-fluoro-piridin-2-ilo			
A-730.	OCH ₃	3-Metilo-5-cloro-piridin-2-ilo			
A-731.	OCH ₃	5-Nitro-piridin-2-ilo			
A-732.	OCH ₃	5-Ciano-piridin-2-ilo			
A-733.	OCH ₃	5-Metoxicarbonilo-piridin-2-ilo			
A-734.	OCH ₃	5-Trifluorometilo-piridin-2-ilo			
A-735.	OCH ₃	5-Metilo-piridin-2-ilo			
A-736.	OCH ₃	4-Metilo-piridin-2-ilo			
A-737.	OCH ₃	6-Metilo-piridin-2-ilo			
A-738.	OCH ₃	3-Piridilo			
A-739.	OCH₃	2-Cloro-piridin-3-ilo			

No.	R ⁴	R ⁵				
A-740.	OCH ₃	2-Bromo-piridin-3-ilo				
A-741.	OCH ₃	2-Metilo-piridin-3-ilo				
A-742.	OCH ₃	2,4-Dicloro-piridin-3-ilo				
A-743.	OCH ₃	2,4-Dibromo-piridin-3-ilo				
A-744.	OCH ₃	2,4-Difluorpiridin-3-ilo				
A-745.	OCH₃	2-Fluoro-4-cloropiridin-3-ilo				
A-746.	OCH ₃	2-Cloro-4-fluoro-piridin-3-ilo				
A-747.	OCH₃	2-Cloro-4-metilo-piridin-3-ilo				
A-748.	OCH₃	2-Metilo-4-fluoro-piridin-3-ilo				
A-749.	OCH₃	2-Metilo-4-cloro-piridin-3-ilo				
A-750.	OCH ₃	2,4-Dimetilo-piridin-3-ilo				
A-751.	OCH₃	2,4,6-Tricloropiridin-3-ilo				
A-752.	OCH₃	2,4,6-Tribrompiridin-3-ilo				
A-753.	OCH₃	2,4,6-Trimetilo-piridin-3-ilo				
A-754.	OCH₃	2,4-Dicloro-6-metilopiridin-3-ilo				
A-755.	OCH₃	4-Piridilo				
A-756.	OCH₃	3-Cloro-piridin-4-ilo				
A-757.	OCH₃	3-Bromo-piridin-4-ilo				
A-758.	OCH ₃	3-Metilo-piridin-4-ilo				
A-759.	OCH ₃	3,5-Dicloro-piridin-4-ilo				
A-760.	OCH ₃	3,5-Dibromo-piridin-4-ilo				
A-761.	OCH ₃	3,5-Dimetilo-piridin-4-ilo				
A-762.	OCH ₃	4-Pirimidinilo				
A-763.	OCH ₃	5-Cloropirimidin-4-ilo				
A-764.	OCH ₃	5-Fluorpirimidin-4-ilo				
A-765.	OCH ₃	5-Fluoro-6-cloropirimidin-4-ilo				
A-766.	OCH ₃	2-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo				
A-767.	OCH ₃	2,5-Dimetilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo				

No.	R⁴	R ⁵			
A-768.	OCH ₃	5-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo			
A-769.	OCH ₃	6-Trifluorometilo-pirimidin-4-ilo			
A-770.	OCH ₃	2-Metilo-5-fluoro-pirimidin-4-ilo			
A-771.	OCH ₃	2-Metilo-5-cloro-pirimidin-4-ilo			
A-772.	OCH ₃	5-Cloro-6-metilo-pirimdin-4-ilo			
A-773.	OCH ₃	5-Cloro-6-etilo-pirimdin-4-ilo			
A-774.	OCH ₃	5-Cloro-6-isopropilo-pirimdin-4-ilo			
A-775.	OCH ₃	5-Bromo-6-metilo-pirimidin-4-ilo			
A-776.	OCH ₃	5-Fluoro-6-metilo-pirimidin-4-ilo			
A-777.	OCH ₃	5-Fluoro-6-fluorometilo-pirimidin-4-ilo			
A-778.	OCH ₃	2,6-Dimetilo-5-cloro-pirimdin-4-ilo			
A-779.	OCH ₃	5,6-Dimetilo-pirimidin-4-ilo			
A-780.	OCH ₃	2,5-Dimetilo-pirimidin-4-ilo			
A-781.	OCH₃	2,5,6-Trimetilo-pirimidin-4-ilo			
A-782.	OCH₃	5-Metilo-6-metoxi-pirimidin-4-ilo			
A-783.	OCH₃	5-Pirimidinilo			
A-784.	OCH ₃	4-Metilo-pirimidin-5-ilo			
A-785.	OCH ₃	4,6-Dimetilo-pirimidin-5-ilo			
A-786.	OCH ₃	2,4,6-Trimetilopirimidin-5-ilo			
A-787.	OCH ₃	4-Trifluorometilo-6-metilo-pirimidin-5-ilo			
A-788.	OCH ₃	2-Pirimidinilo			
A-789.	OCH ₃	4,6-Dimetilopirimidin-2-ilo			
A-790.	OCH ₃	4,5,6-Trimetilopirimidin-2-ilo			
A-791.	OCH ₃	4,6-Ditrifluorometilo-pirimidin-2-ilo			
A-792.	OCH ₃	4,6-Dimetilo-5-cloro-pirimidin-2-ilo			
A-793.	CI	Fenilo			
A-794.	CI	2-Fluorofenilo			
A-795.	CI	3-Fluorofenilo			

No.	R ⁴	R ⁵			
A-796.	Cl	4-Fluorofenilo			
A-797.	CI	2-Clorofenilo			
A-798.	CI	3-Clorofenilo			
A-799.	CI	4-Clorofenilo			
A-800.	CI	3-Bromofenilo			
A-801.	CI	4-Bromofenilo			
A-802.	CI	2-Trifluorometilofenilo			
A-803.	CI	3-Trifluorometilofenilo			
A-804.	CI	4-Trifluorometilofenilo			
A-805.	CI	2-(Metilotio)fenilo			
A-806.	CI	3-(Metilotio)fenilo			
A-807.	CI	4-(Metilotio)fenilo			
A-808.	CI	2-Metoxifenilo			
A-809.	CI	3-Metoxifenilo			
A-810.	CI	4-Metoxifenilo			
A-811.	CI	4-Nitrofenilo			
A-812.	CI	4-Cianofenilo			
A-813.	CI	4-tercButilofenilo			
A-814.	CI	4-Isopropilofenilo			
A-815.	CI	3-Etoxifenilo			
A-816.	CI	4-Etoxifenilo			
A-817.	CI	4-n-Propoxifenilo			
A-818.	CI	3-Isopropoxifenilo			
A-819.	CI	4-Isopropoxifenilo			
A-820.	CI	4-n-Butoxifenilo			
A-821.	CI	4-tercButoxifenilo			
A-822.	CI	4-(Metoxiiminometilo)fenilo			
A-823.	CI	4-(1-(Metoxiimino)etilo)fenilo			

No.	R⁴	R ⁵				
A-824.	Cl	2,3-Difluorofenilo				
A-825.	CI	2,4-Difluorofenilo				
A-826.	CI	2,5-Difluorofenilo				
A-827.	CI	3,4-Difluorofenilo				
A-828.	CI	3,5-Difluorofenilo				
A-829.	CI	2,6-Difluorofenilo				
A-830.	CI	2,4,6-Trifluorofenilo				
A-831.	Cl	2,4,5-Trifluorofenilo				
A-832.	Cl	2,3,4-Trifluorofenilo				
A-833.	Cl	2,3,5-Trifluorofenilo				
A-834.	Cl	3,4,5-Trifluorofenilo				
A-835.	Cl	2,3-Diclorofenilo				
A-836.	CI	2,5-Diclorofenilo				
A-837.	CI	3,5-Diclorofenilo				
A-838.	CI	2,6-Diclorofenilo				
A-839.	CI	2,3-Dimetilofenilo				
A-840.	Cl	2,4-Dimetilofenilo				
A-841.	CI	2,5-Dimetilofenilo				
A-842.	Cl	2,4,5-Trimetilofenilo				
A-843.	CI	2,3-Dimetoxifenilo				
A-844.	CI	2,4-Dimetoxifenilo				
A-845.	CI	3,4-Dimetoxifenilo				
A-846.	CI	2,4-Bis(trifluorometilo)fenilo				
A-847.	CI	3,5-Bis(trifluorometilo)fenilo				
A-848.	CI	2-Metilo-3-metoxifenilo				
A-849.	CI	2-Metilo-4-metoxifenilo				
A-850.	CI	2-Metilo-6-metoxifenilo				
A-851.	CI	3-Cloro-4-fluorofenilo				

No.	R⁴	R ⁵				
A-852.	CI	2-Cloro-4-fluorofenilo				
A-853.	CI	2-Cloro-6-fluorofenilo				
A-854.	CI	4-Cloro-2-fluorofenilo				
A-855.	CI	5-Cloro-2-fluorofenilo				
A-856.	CI	1-Fluoro-3-metilofenilo				
A-857.	CI	2-Fluoro-4-metilofenilo				
A-858.	CI	4-Fluoro-2-metilofenilo				
A-859.	CI	2-Fluoro-3-metoxifenilo				
A-860.	CI	2-Fluoro-4-metoxifenilo				
A-861.	CI	2-Fluoro-6-metoxifenilo				
A-862.	CI	2-Fluoro-4-trifluorometilofenilo				
A-863.	CI	4-Cloro-3-metilofenilo				
A-864.	CI	2-Cloro-4-metilofenilo				
A-865.	CI	2-Cloro-6-metilofenilo				
A-866.	CI	5-Cloro-2-metilofenilo				
A-867.	CI	3-Cloro-2-metilofenilo				
A-868.	CI	2-Cloro-4-metoxifenilo				
A-869.	CI	2-Cloro-6-metoxifenilo				
A-870.	CI	2-Cloro-4-trifluorometilofenilo				
A-871.	CI	3-Fluoro-4-metilofenilo				
A-872.	CI	3-Fluoro-4-isopropilofenilo				
A-873.	CI	4-Fluoro-3-metilofenilo				
A-874.	CI	3-Fluoro-4-metoxifenilo				
A-875.	CI	3-Fluoro-4-etoxifenilo				
A-876.	CI	3-Fluoro-4-trifluorometilofenilo				
A-877.	CI	3-Cloro-4-metilofenilo				
A-878.	CI	3-Cloro-4-metoxifenilo				
A-879.	CI	3-Cloro-4-etoxifenilo				

No.	R ⁴	R ⁵					
A-880.	CI	3-Cloro-4-trifluorometilofenilo					
A-881.	CI	3-Metilo-4-metoxifenilo					
A-882.	CI	4-Cloro-2,5-difluorofenilo					
A-883.	CI	4-tercButilo-2-fluorofenilo					
A-884.	CI	2-Fluoro-4-isopropilofenilo					
A-885.	CI	4-Etoxi-2-fluorofenilo					
A-886.	CI	4-Acetilo-2-fluorofenilo					
A-887.	CI	2-Tienilo					
A-888.	CI	5-Metilotiofen-2-ilo					
A-889.	CI	4-Metilotiofen-2-ilo					
A-890.	CI	5-Clorotiofen-2-ilo					
A-891.	CI	3-Cianotiofen-2-ilo					
A-892.	CI	5-Formilotiofen-2-ilo					
A-893.	CI	5-Acetilotiofen-2-ilo					
A-894.	CI	5-(Metoxiiminometilo)tiofen-2-ilo					
A-895.	CI	5-(1-(Metoxiimino)etilo)tiofen-2-ilo					
A-896.	CI	4-Bromtiofen-2-ilo					
A-897.	CI	3,5-Diclorotiofen-2-ilo					
A-898.	CI	3-Tienilo					
A-899.	CI	2-Metilotiofen-3-ilo					
A-900.	CI	2,5-Diclorotiofen-3-ilo					
A-901.	CI	2,4,5-Tricloro-tiofen-3-ilo					
A-902.	CI	2-Furilo					
A-903.	CI	5-Metilofuran-2-ilo					
A-904.	CI	5-Clorofuran-2-ilo					
A-905.	CI	4-Metilofuran-2-ilo					
A-906.	CI	3-Cianofuran-2-ilo					
A-907.	CI	5-Acetilofuran-2-ilo					

No.	R ⁴	R ⁵				
A-908.	CI	3-Furilo				
A-909.	CI	2-Metilofuran-3-ilo				
A-910.	CI	2,5-Dimetilofuran-3-ilo				
A-911.	CI	2-Piridilo				
A-912.	CI	3-Fluoro-piridin-2-ilo				
A-913.	CI	3-Cloro-piridin-2-ilo				
A-914.	CI	3-Brompiridin-2-ilo				
A-915.	CI	3-Trifluorometilo-piridin-2-ilo				
A-916.	CI	3-Metilo-piridin-2-ilo				
A-917.	CI	3-Etilo-piridin-2-ilo				
A-918.	CI	3,5-Difluoro-piridin-2-ilo				
A-919.	CI	3,5-Dicloro-piridin-2-ilo				
A-920.	CI	3, 5-Dibromo-pirid in-2-ilo				
A-921.	CI	3,5-Dimetilo-piridin-2-ilo				
A-922.	Cl	3-Fluoro-5-trifluorometilo-piridin-2-ilo				
A-923.	CI	3-Cloro-5-fluoro-piridin-2-ilo				
A-924.	CI	3-Cloro-5-metilo-piridin-2-ilo				
A-925.	CI	3-Fluoro-5-cloro-piridin-2-ilo				
A-926.	CI	3-Fluoro-5-metilo-piridin-2-ilo				
A-927.	CI	3-Metilo-5-fluoro-piridin-2-ilo				
A-928.	CI	3-Metilo-5-cloro-piridin-2-ilo				
A-929.	CI	5-Nitro-piridin-2-ilo				
A-930.	Cl	5-Ciano-piridin-2-ilo				
A-931.	CI	5-Metoxicarbonilo-piridin-2-ilo				
A-932.	CI	5-Trifluorometilo-piridin-2-ilo				
A-933.	CI	5-Metilo-piridin-2-ilo				
A-934.	CI	4-Metilo-piridin-2-ilo				
A-935.	CI	6-Metilo-piridin-2-ilo				

No.	R⁴	R ⁵				
A-936.	CI	3-Piridilo				
A-937.	CI	2-Cloro-piridin-3-ilo				
A-938.	CI	2-Bromo-piridin-3-ilo				
A-939.	CI	2-Metilo-piridin-3-ilo				
A-940.	CI	2,4-Dicloro-piridin-3-ilo				
A-941.	CI	2,4-Dibromo-piridin-3-ilo				
A-942.	CI	2,4-Difluorpiridin-3-ilo				
A-943.	CI	2-Fluoro-4-cloropiridin-3-ilo				
A-944.	CI	2-Cloro-4-fluoro-piridin-3-ilo				
A-945.	CI	2-Cloro-4-metilo-piridin-3-ilo				
A-946.	CI	2-Metilo-4-fluoro-piridin-3-ilo				
A-947.	CI	2-Metilo-4-cloro-piridin-3-ilo				
A-948.	CI	2,4-Dimetilo-piridin-3-ilo				
A-949.	CI	2,4,6-Tricloropiridin-3-ilo				
A-950.	CI	2,4,6-Tribrompiridin-3-ilo				
A-951.	CI	2,4,6-Trimetilo-piridin-3-ilo				
A-952.	CI	2,4-Dicloro-6-metilopiridin-3-ilo				
A-953.	CI	4-Piridilo				
A-954.	CI	3-Cloro-piridin-4-ilo				
A-955.	CI	3-Bromo-piridin-4-ilo				
A-956.	CI	3-Metilo-piridin-4-ilo				
A-957.	CI	3,5-Dicloro-piridin-4-ilo				
A-958.	CI	3,5-Dibromo-piridin-4-ilo				
A-959.	CI	3,5-Dimetilo-piridin-4-ilo				
A-960.	CI	4-Pirimidinilo				
A-961.	CI	5-Cloropirimidin-4-ilo				
A-962.	CI	5-Fluorpirimidin-4-ilo				
A-963.	CI	5-Fluoro-6-cloropirimidin-4-ilo				

No.	R⁴	R ⁵				
A-964.	CI	2-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo				
A-965.	CI	2,5-Dimetilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo				
A-966.	CI	5-Metilo-6-trifluorometilo-pirimidin-4-ilo				
A-967.	CI	6-Trifluorometilo-pirimidin-4-ilo				
A-968.	CI	2-Metilo-5-fluoro-pirimidin-4-ilo				
A-969.	CI	2-Metilo-5-cloro-pirimidin-4-ilo				
A-970.	CI	5-Cloro-6-metilo-pirimdin-4-ilo				
A-971.	CI	5-Cloro-6-etilo-pirimdin-4-ilo				
A-972.	CI	5-Cloro-6-isopropilo-pirimdin-4-ilo				
A-973.	CI	5-Bromo-6-metilo-pirimidin-4-ilo				
A-974.	CI	5-Fluoro-6-metilo-pirimidin-4-ilo				
A-975.	CI	5-Fluoro-6-fluorometilo-pirimidin-4-ilo				
A-976.	CI	2,6-Dimetilo-5-cloro-pirimdin-4-ilo				
A-977.	CI	5,6-Dimetilo-pirimidin-4-ilo				
A-978.	CI	2,5-Dimetilo-pirimidin-4-ilo				
A-979.	CI	2,5,6-Trimetilo-pirimidin-4-ilo				
A-980.	CI	5-Metilo-6-metoxi-pirimidin-4-ilo				
A-981.	CI	5-Pirimidinilo				
A-982.	CI	4-Metilo-pirimidin-5-ilo				
A-983.	CI	4,6-Dimetilo-pirimidin-5-ilo				
A-984.	CI	2,4,6-Trimetilopirimidin-5-ilo				
A-985.	CI	4-Trifluorometilo-6-metilo-pirimidin-5-ilo				
A-986.	CI	2-Pirimidinilo				
A-987.	CI	4,6-Dimetilopirimidin-2-ilo				
A-988.	CI	4,5,6-Trimetilopirimidin-2-ilo				
A-989.	CI	4,6-Ditrifluorometilo-pirimidin-2-ilo				
A-990.	CI	4,6-Dimetilo-5-cloro-pirimidin-2-ilo				

Los compuestos de la invención de la fórmula general I pueden prepararse de manera análoga al estado de la técnica citado al inicio mediante métodos estándar de la síntesis orgánica.

Compuestos de la fórmula I donde R⁵ representa fenilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos, pueden prepararse, por ejemplo, de acuerdo con el método representado en el esquema 1:

Esquema 1:

5

25

En el esquema 1 R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados nombrados antes. Ar representa fenilo opcionalmente sustituido o representa hetarilo de 5 ó 6 miembros, opcionalmente sustituido. R representa H o alquilo de C_1 - C_4 o forma con otras moléculas Ar-B(OR) $_2$ un anhídrido de ácido fenilborónico. Hal representa cloro, bromo o yodo.

Según el esquema 1, la 2-(6-halopiridin-2-il)triazina de la fórmula II reacciona con un derivado de ácido 10 (het)arilborónico de la fórmula general Ar-B(OR)2 en las condiciones de un acoplamiento Suzuki, es decir en presencia de un catalizador de paladio en condiciones de reacción conocidas de por sí, tal como se conocen por ejemplo de Acc. Chem. Res. 15, páginas 178-184 (1982), Chem. Rev. 95, páginas 2457-2483 (1995), y de la literatura allí citada, así como de J. Org. Chem. 68, página 9412 (2003). Catalizadores adecuados son, en particular, Tetrakis(trifenilfosfin)paladio(0), cloruro de bis(trifenilfosfin)paladio(II), cloruro de bis(acetonitril)paladio(II), el [1,1'-bis-(difenilfosfino)ferrocen]paladio(II) -diclorometano, 15 complejo cloruro de bis(difenilfosfin)etan]paladio(0) y cloruro de [1,4-bis(difenilfosfin)butan]paladio(II). La cantidad de catalizador es usualmente de 0,1 a 10 mol-%, respecto del compuesto II. La proporción molar entre el compuesto II y el derivado de ácido (het)arilborónico se encuentra típicamente en el rango de 1:2 a 2:1.

De manera análoga al esquema 1 pueden prepararse compuestos de la fórmula I en los que R⁵ representa alquilo, cicloalquilo, bencilo opcionalmente sustituido o heteroarilmetilo, por la vía de una reacción de acoplamiento catalizada por metal de transición mediante reacción de compuesto II con un compuesto organometálico Met-R⁵, donde R⁵ tiene el significado mencionado previamente y Met representa un residuo MgX, SnR³ o ZnX (X = cloro, bromo o yodo, R = alquilo), por ejemplo en el sentido de un acoplamiento de Stille o acoplamiento de Kumada.

En una forma análoga al esquema 1 pueden prepararse compuestos de la fórmula I, donde R⁵ representa alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, fenoxi opcionalmente sustituido o heteroariloxi, mediante reacción de compuesto II con el alcoholato correspondiente OR⁵, donde R⁵ tiene el significado nombrado previamente, en el sentido de una sustitución nucleofílica.

Las 3-(6-halopiridin-2-il)-triazinas de la fórmula II pueden prepararse por su parte según los métodos representados en los siguientes esquemas a partir de los compuentos de amidina correspondientes de la fórmula III.

30 La preparación de compuestos II, donde R¹, R², independientemente uno de otro, representan alquilo, haloalquilo o conjuntamente con los átomos de C a los que están enlazados forman un carbociclo saturado o un heterociclo según la definición de arriba, se logra, por ejemplo, de acuerdo con la síntesis representada en el esquema 2.

Esquema 2:

5

20

25

En el esquema 2 Hal, R^3 y R^4 tienen los significados indicados previamente. R^1 y R^2 representan, independientemente uno de otro, alquilo de C_1 - C_8 , haloalquilo de C_1 - C_8 o forman conjuntamente con los átomos de C a los que están enlazados un carbociclo saturado o un heterociclo, por ejemplo uno de los ciclos nombrados previamente Q-1, Q-4 o Q-8. Según el esquema 2 los compuestos de amidina de la fórmula III reaccionan de manera sucesiva o como reacción en un recipiente con hidrazina y el compuesto IV, en cuyo caso se obtiene el compuesto de la fórmula II. Regularmente primero se efectúa la reacción con la hidrazina, la cual se emplea de manera típica como hidrato de hidracina. A continuación se adiciona el compuesto IV. Opcionalmente la temperatura se eleva hasta completar la reacción.

Los compuestos de la fórmula IV son conocidos o pueden prepararse según métodos estándar, por ejemplo según EP 267 378, Tetrahedron Letters, 2003, página 2307, Tetrahedron Letters, 1992, página 8131, Tetrahedron Letters, 1987, página 551, J. Molec. Catalysis 208 (1-2), 2004, páginas 135-145. La preparación de 3,4-dioxaoxolano se logra, por ejemplo, mediante oxidación del 3,4-bishidroxioxolano con N-bromosuccinimida y tetraclorometano en piridina (véase Tetrahedron Letters, 44 (2003) página 4909 o con ácido o-yodoisobenzoico en dimetilsulfóxido (véase Tetrahedron Letters, 35 (1994) página 8019). Los compuestos de amidina III también son conocidos o pueden prepararse, por ejemplo, de manera análoga a los métodos descritos en US 2003/0087940 A1 y Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003).

De manera análoga al esquema II pueden prepararse los compuestos de la fórmula II, donde R¹ y R² conjuntamente con los átomos de C a los que están enlazados representan un residuo Q-2 o Q-3, por la ruta de síntesis mostrada en los esquemas 3 y 4:

Esquema 3:

En el esquema 3 Hal, k, R^b , R^3 y R^4 tienen los significados nombrados previamente. A representa CH_2 o o un enlace químico. R representa alquilo de C_1 - C_4 , en particular metilo o etilo. Según el esquema 3, los compuestos de amidina III reaccionan de manera sucesiva con hidrazina y con el éster de la fórmula V. Respecto de las condiciones de reacción es válido lo dicho para el esquema 2 de manera análoga. El compuesto bishidroxilo de la fórmula VI obtenido de esta manera se somete luego a una deshidratación ciclizante, por ejemplo mediante tratamiento con ácido sulfúrico. Los ésteres de la fórmula V son conocidos o pueden prepararse de manera análoga a los métodos conocidos en la literatura (véase J. Heterocicl. Chem., 32 (1995) página 735 y Liebigs Ann. Chem. 1974, páginas 468-476).

Los compuestos de la fórmula general III pueden prepararse por su parte a partir de los compuestos correspondientes de 2-cianopiridina de la fórmula general VII (véase esquema 4). Para este propósito el compuesto 2-cianopiridina VII se transforma en el compuesto III según el métodos descrito en US 4,873,248 por medio de tratamiento sucesivo con alcoholato de metal alcalino, tal como metanolato o etanolato de sodio y la reacción a continuación con cloruro de amonio. En lugar de los clorhidratos también pueden usarse en los pasos siguientes

mostrados en los esquemas 1 a 3 los bromohidratos, acetatos, sulfatos o formiatos. Las cianopiridinas de la fórmula VII son conocidas, por ejemplo de US 2003/087940, WO 2004/026305, WO 01/057046 y Bioorg. Med. Chem. Lett., páginas 1571-1574 (2003) o pueden prepararse de acuerdo con métodos de preparación conocidos.

Según una segunda ruta de síntesis (véase esquema 4) pueden producirse los compuestos de la invención, en los que R⁵ representa un residuo Ar, tal como se define en el esquema 1 a partir de las cianopiridinas VII. Para esto primero se realiza un acoplamiento del compuesto VII con el compuesto de ácido (het)arilborónico Ar-B(OR)₂, tal como se describe para el esquema 1 y la 6-(het)aril-2-cianopiridina obtenida en este caso se transforma en las condiciones de reacción descritas para los compuestos VII en el compuesto de amidina IX. El compuesto IX puede transformarse luego en el compuesto de triazina correspondiente en las condiciones nombradas para los esquemas 2 y 3.

Esquema 4:

5

10

Por lo demás se conocen los compuestos de la fórmula VIIIa donde R⁵ tiene uno de los significados nombrados previamente, en particular un significado diferente de Ar. Los compuestos VIIIa pueden transformarse en los compuestos I correspondientes de la invención según los métodos análogos a los esquemas 2 a 4:

Esquema 4a

Los compuestos de la fórmula general VII pueden prepararse, siempre que no sean conocidos, en particular según el método representado en el esquema 5.

Esquema 5:

$$R^4$$
 R^3
 R^4
 R^4
 R^3
 R^4
 R^4

En el esquema 5, R³ y R⁴ tienen los significados nombrados previamente. Hal* representa cloro, bromo o yodo.

- La conversión de la 2-halopiridina X en 2-cianopiridina XI se logra de acuerdo con métodos estándar de la química 5 orgánica mediante reacción de X con iones cianuro, por ejemplo con cianuro de sodio o de potasio (véase EP-A 97460, ejemplo de preparación 1), cianuro de cobre (I) (véase EP-A 34917, ejemplo de preparación 3) o cianuro de trimetilsililo. A continuación, el compuesto XI obtenido de esta forma se convierte en el óxido N-piridina XII mediante tratamiento con un perácido de acuerdo con métodos conocidos de por sí. La conversión de XI en XII puede 10 efectuarse de manera análoga a los métodos conocidos, por ejemplo mediante tratamiento de XI peróxido de hidrógeno en un ácido orgánico como ácido fórmico, ácido acético, ácido cloroacético o ácido trifluoroacético (véase por ejemplo J. Org. Chem. 55, páginas 738-741 (1990) y Organic Synthesis, Collect. Vol. IV, páginas 655-656 (1963)) o mediante reacción de XI con un perácido orgánico como ácido meta-cloroperbenzoico en un solvente inerte, por ejemplo un hidrocarburo halogenado como diclorometano o dicloroetano (véase, por ejemplo, Synthetic 15 Commun. 22(18), página 2645, (1992); J. Med. Chem. 2146 (1998)). La conversión de XI en XII también se logra de manera análoga al método descripo por K. B. Sharpless (J. Org. Chem. 63(5), página 7740 (1998)) mediante reacción de XI con peróxido de hidrógeno en un hidrocarburo halogenado como diclorometano o dicloroetano en presencia de cantidades catalíticas (por ejemplo 5 % en peso) compuestos de renio (VII) como metiltrioxorenio (H₃CReO₃).
- A continuación XII reacciona con un agente de halogenación como POCl₃ o POBr₃, en cuyo caso se obtiene el compuesto VII correspondiente. En la reacción de XII para llegar a VII regularmente el agente de halogenación se emplea en exceso con respecto de la estequiometria de la reacción. La reacción puede realizarse en un solvente orgánico inerte y con frecuencia se efectúa en ausencia de un solvente, en cuyo caso en tonces, por lo regular, el agente de halogenación funge como solvente. La temperatura de reacción se encuentra habitualmente en el rango de 20 °C hasta la temperatura de ebullición del agente de halogenación. Opcionalmente es ventajoso introducir con un agente de cloración, como POCl₃, un átomo de cloro a la posición 2 del óxido-N-piridina XII y a continuación proceder a un intercambio de halógeno, por ejemplo mediante tratamiento con HBr o un agente de yodación, en cuyo caso se obtiene un compuesto de la fórmula VII con Hal = Br o I.

Además, pueden prepararse los compuestos I de la invención según la síntesis representada en el esquema 6:

Esquema 6:

5

10

15

20

En el esquema 6, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados nombrados previamente. R^x representa, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 , especialmente n-butilo, o representa fenilo.

De acuerdo con el esquema 6, en un primer paso según métodos estándar de la química orgánica se transfiere el compuesto de piridina XIII al óxido-N XIV correspondiente. Los métodos nombrados en el esquema 5 para la conversión del compuesto XI en el compuesto XII pueden aplicarse de manera correspondiente. El óxido – N XIV se convierte a continuación con un medio de cloración como POCI3 en la correspondiente 2-cloropiridina XV. Los métodos nombrados en el esquema 5 para la conversión del compuesto XII en el compuesto VII pueden aplicarse de manera correspondiente. A continuación se realiza un intercambio de cloro – bromo según métodos estándar de la química orgánica, por ejemplo mediante tratamiento de la cloropiridina XV con HBr de manera análoga a los métodos nombrados en US 5,271,217 y Can. J. Chem. 75 (2) (1997) página 169.

La bromopiridina obtenida de esta manera se acopla a continuación con el compuesto de triazina XVII. Para este propósito mediante un tratamiento con base de litio, en particular con un compuesto de alquilo de C₁-C₆ - litio tal como n-butil-litio o fenil-litio se transfiere el compuesto de triazina XVII al correspondiente compuesto litio – triazina, el cual a continuación se hace reaccionar con el compuesto de bromopiridina XVI. La reacción de XVI con el compuesto XVII litiado puede realizarse de manera análoga al método descrito en Tetrahedron Lett. 41(10) (2000) página 1653.

Los compuestos de triazina XVII son conocidos o pueden prepararse por analogía a métodos conocidos para la preparación de compuestos de triazina. Los compuestos de triazina XVII, en los que R¹ y R² pueden representar residuos unidos por oxígeno pueden prepararse a partir de 5,6-dialcoxi-1,2,4-triazinas como 5,6-dimetoxi-1,2,4-triazina (véase Chem, Ber. 109 (1976), p. 1113):

Esquema 7:

$$N \rightarrow OR^{1a}$$
 $N \rightarrow OR^{2a}$
 $N \rightarrow OH$
 N

En el esquema 7, R^b y k tienen los significados mencionados con anterioridad. R^{1a} y R^{1b} representan alquilo de C₁-C₆, en particular metilo. R^c y R^d representan, independientemente uno de otro, hidrógeno o alquilo C₁-C₄. La transformación de XVIII en la 5,6-bishidroxi-1,2,4-triazina resulta por analogía al método descrito en Chem. Ber. 109 (1976), p. 1113. La bishidroxitriazina XIX obtenida de esta manera puede hacerse reaccionar luego con un 1,2-dibromoalcano XX, con preferencia en presencia de una base como hidróxido de metal alcalino o alcoholato alcalino por analogía al método descrito en Heterocicl. Chem. 27 (1990), p. 151, en donde se obtiene la triazina XVIIa condensada. Además, puede hacerse reaccionar la bishidroxitriazina XIX por analogía al método descrito en Chem. Berichte 124(3) (1991) p. 481. J. Chem. Socl., Perkin Trans 1, 1998, p. 3561; Synthesis (1986), p. 122; con una cetona o aldehído XXI, en cuyo caso se obtiene la triazina XVIIb concentrada.

Las mezclas de reacción obtenidas por medio de los métodos representados en los esquemas 1 a 7 se elaboran de manera usual, por ejemplo, por mezcla con agua, separación de las fases y eventualmente purificación cromatográfica de los productos crudos. Los productos intermediarios y finales se producen, en parte, en forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente amarronados, que se liberan a presión reducida y a temperatura moderadamente elevada de partes volátiles o se purifican. Siempre que se obtengan productos intermediarios y finales como sólidos, la purificación también puede realizarse por recristalización o digestión.

Si no puede accederse a los distintos compuestos I por medio de las vías antes descritas, pueden prepararse por derivación de otros compuestos I.

Siempre que se produzcan mezclas isoméricas en la síntesis, en general no es indispensable una separación, ya que los distintos isómeros pueden convertirse uno en otro parcialmente durante la preparación para el uso o durante la aplicación (por ejemplo, por acción de la luz, los ácidos o las bases). Las correspondientes conversiones también pueden efectuarse después de la aplicación, por ejemplo, en el tratamiento de plantas, en la planta tratada o en el hongo dañino por combatir.

Los compuestos de la fórmula I son adecuados como fungicidas. Se distinguen por una eficacia excelente contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, del orden de los ascomicetes, deuteromicetes, oomicetes y basidiomicetes, en particular de la clase de los oomicetes. En parte son sistémicamente eficaces y pueden aplicarse como fungicidas para hojas, de acción desinfectante y para suelos en la protección de las plantas.

Poseen particular importancia para combatir un gran número de hongos en diferentes cultivos, tales como trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, pasto, bananas, algodón, soya, café, caña de azúcar, vino, frutales y plantas de adorno y hortalizas tales como pepinos, frijoles, tomates, papas y cucurbitáceas, así como las semillas de estas plantas.

En especial son adecuados para combatir las siguientes fitoenfermedades:

- Especies de Alternaría en verduras, colza, remolachas, frutas, arroz, habas de soya, así como en patatas (por ejemplo, A. solani o A. alternata) y tomates (por ejemplo, A. solani o A. alternata) y Alternaría ssp. (tizón de espigas) en trigo,
- Especies de Aphanomyces en remolachas y hortalizas,

5

10

15

20

30

35

- Especies de Ascochita en cereales y hortalizas, por ejemplo Ascochita tritici (tizón del brote) en trigo,
- Especies de bipolaris y Drechslera en maíz, cereal, arroz y grama (por ejemplo D. maydis en maíz, D. teres en cebada, D. tritici-repentis en trigo),
- Blumeria graminis (oidios) en cereales (por ejemplo trigo o cebada),
- 5 Botrytis cinerea (podredumbre gris) en fresas, hortalizas, flores, trigo y vides,
 - Bremia lactucae en lechuga,
 - Especies de cercospora en maíz, habas de soya, arroz y remolacha y por ejemplo Cercospora sojina (manchas de hojas) o Cercospora kikuchii (manchas de hojas) an Sojabohnen, .
 - Cladosporium herbarum (tizón de la espiga) en trigo,
- Especies de Cochliobolus en maíz, cereales, arroz (por ejemplo, Cochliobolus sativus en cereales, Cochliobolus miyabeanus en arroz).
 - Especies de Colletotricum en habas de soya, algodón y otros vegetales (por ejemplo, C. acutatum en diversas plantas) y por ejemplo Colletotrichum truncatum (antracnosis) en habas de soya),
 - Corynespora cassiicola (manchas en hojas) en habas de soya,
- Dematofora necatrix (podredumbre de raíz/de tallo) en habas de soya,
 - Diaporthe faseolorum (enfermedad de tallo) en habas de soya,
 - Especies de Drechslera, especies de Pirenofora en maíz, cereales, arroz y césped, en cebada (por ejemplo, D. teres) y en trigo (por ejemplo, D. tritici-repentis),
- Esca en vid, provocada por Faeoacremonium chlamydosporium, Ph. Aleofilum, y Fomitipora punctata (syn. Fellinus punctatus),
 - Elsinoe ampelina en vid,
 - Epicoccum spp. (tizón de la espiga) en trigo,
 - Exserohilum Arten en maíz,
 - Erysife cichoracearumy Sfaerotheca fuliginea en plantas de pepinos,
- Especies de Fusarium y Verticillium (por ejemplo, V. dahliae) en diferentes plantas: por ejemplo, F. graminearum o F. culmorum (podredumbre de raíces) en cereales (por ejemplo, trigo o cebada) o, por ejemplo, F. oxisporum en tomates y Fusarium solani (enfermedad de tallo) en habas de soya.
 - Gaeumanomyces graminis en cereales (por ejemplo, trigo o cebada),
 - Especies de Gibberella en cereales y arroz (por ejemplo, Gibberella fujikuroi en arroz),
- Glomerella cingulata en vid y otras plantas,
 - Grainstaining complex en arroz,
 - Guignardia budwelli en vid,
 - Especies de Helminthosporium (por ejemplo, H. graminicola) en maíz y arroz,
 - Isariopsis clavispora en vid,
- Macrofomina faseolina (podredumbre de raíz/de tallo) en habas de soya,

- Michrodochium nivale en cereales (por ejemplo, trigo o cebada),
- Microsfaera diffusa (oidios) en habas de soya,
- Especies de Mycosfaerella Arten en cereales, bananas y cacahuates (M. graminicola en trigo, M. fijiesis en banana),
- Especies de Peronospora en col (por ejemplo P. brassicae), plantas de cebolla (por ejemplo, P. destructor) y por ejemplo Peronospora manshurica (mildiú) en habas de soya,
 - Fakopsara pachirhizi y Fakopsara meibomiae en habas de soya,
 - Fialofora gregata (enfermedad de tallo) en habas de soya,
 - Especies de Fomopsis en habas de soya, girasoles y vides (P. viticola en vides, P. heliantii en girasoles),
- Especies de Fitophthora en diferentes plantas, por ejemplo P. capsici en pimentón, Fitophtora megasperma (podredumbre de hoja/de tallos) en habas de soya, Fitophthora infestans en patatas y tomates.
 - Plasmopara viticola en vides,
 - Podosfaera leucotricha en manzanos,
 - Pseudocercosporella herpotrichoides en cereales,
- Especies de Pseudoperonospora en lúpulo y vegetales de pepino (por ejemplo, P. cubenis en pepino o P. humili en lúpulo)
 - Pseudopezicula tracheifilai en vid,
 - Especies de Puccinia en diferentes plantas, por ejemplo P. triticina, P. striformins, P. hordei o P. graminis en cereales (por ejemplo, trigo o cebada) o en espárragos (por ejemplo, P. asparagi),
- Especies de Pirenofora en cereales.
 - Piricularia oryzae, Corticium sasakii, Sarocladium oryzae, S. attenuatum, Entiloma oryzae en arroz, Piricularia grisea en césped y cereales,
 - Pitium spp. en césped, arroz, maíz, algodón, colza, girasoles, remolacha, hortalizas y otras plantas (por ejemplo, P. ultiumum o P. afanidermatum),
- 25 Ramularia collo-cigni (complejo ramularia/escaldado /physiological leaf spots) en cebada,
 - Especies de Rhizoctonia (por ejemplo, R. solani) en algodón, arroz, patatas, césped, maíz, colza, remolacha, hortalizas y otras plantas, por ejemplo Rhizoctonia solani (podredumbre de raíz/ de tallo) en habas de soya o Rhizoctonia cerealis (mancha ocular aguda) en trigo o cebada,
 - Rhinchosporium secalis en cebada (manchas de hoja), cebada y triticale,
- Especies de Sclerotinia en colza, girasoles y otras plantas, por ejemplo Sclerotinia sclerotiorum (enfermedad de tallo) o Sclerotinia rolfsii (enfermedad de tallo) en habas de soya,
 - Septoria glycines (manchas de hoja) en habas de soya,
 - Septoria tritici y Stagonospora nodorum en trigo,
 - Erysife (syn. Uncinulanecator) en vid,
- 35 Setospaeria Arten en maíz y césped,
 - Sfacelotheca reilinia en maíz,

- Stagonospora nodorum (septoriosis de espiga) en trigo,
- Especies de Tievaliopsis en habas de soya y algodón,
- Especies de Tilletia en cereales,

20

40

- Tiphula incamata (podredumbre de nieve) en trigo o cebada,
- 5 Especies de Ustilago en cereales, maíz y remolacha y
 - Especies de Venturia (roña) en manzano y pera (por ejemplo, V. inaequalis en manzanoo).

Los compuestos de la fórmula I son adecuados además para combatir hongos dañinos en la protección de materiales (por ejemplo, madera, papel, dispersiones para la pintura, fibras o tejidos) y en la protección de depósitos. En la protección de madera se toman en consideración particularmente los siguientes hongos dañinos:

Ascomicetes como Ofiostoma spp., Ceratocistis spp., Aureobasidium pullulans, Sclerofoma spp., Chaetomium spp., Humicola spp., Petriella spp., Trichurus spp.; basidiomicetes como Coniofora spp., Coriolus spp., Gloeofillum spp., Lentinus spp., Pleurotus spp., Poria spp., Serpula spp. y Tiromyces spp., deuteromicetes como Aspergillus spp., Cladosporium spp., Penicillium spp., Trichoma spp., Alternaria spp., Paecilomyces spp. y zigomicetes como Mucor spp., además, los siguientes hongos de levadura en la protección de materiales: Candida spp. y Saccharomyces cerevisae.

Los compuestos de la fórmula I se aplican tratando los hongos o las plantas, semillas, materiales o suelo a proteger frente a la infestación de hongos con una cantidad efectiva fungicida de las sustancias activas. La aplicación puede efectuarse tanto antes como después de la infección de los materiales, plantas o semillas por parte de los hongos.

Los agentes fungicidas contienen en general entre 0,1 y 95, preferentemente entre 0,5 y 90 % en peso de sustancia activa.

Las cantidades de aplicación se encuentran, en el caso de aplicación en la protección de plantas según el tipo del efecto deseado, entre 0,01 y 2,0 kg sustancia activa por ha.

En el caso de tratamiento de semillas se necesitan en general cantidades de sustancia activa de 1 a 1000 g/100 kg, preferentemente 5 a 100 g/100 kg de semilla.

- En el caso de la aplicación en la protección de material o de depósitos, la cantidad de aplicación de la sustancia activa se rige por el tipo del campo de aplicación y del efecto deseado. Cantidades usuales de aplicación en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,001 g hasta 2 kg, preferentemente de 0,005 g hasta 1 kg de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.
- Los compuestos de la fórmula I pueden presentarse en diversas modificaciones cristalinas que se distinguen en la actividad biológica. Estas también son objeto de la presente invención.

Los compuestos de la fórmula I pueden transferirse a las formulaciones usuales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. La aplicación se rige por el respectivo propósito de uso; en cada caso debe garantizar un distribución fina y uniforme del compuesto de la invención.

- Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo extendiendo la sustancia activa con solventes y/o vehículos, si se desea usando emulsionantes y dispersantes. Como solventes / vehículos se toman en consideración esencialmente:
 - Agua, solventes aromáticos (por ejemplo, productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo, fracciones de petróleo), alcoholes (por ejemplo, metanol, butanol, pentanol, benciloalcohol), cetonas (por ejemplo, ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidona (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido graso de dimetilo, ácidos grasos y ésteres de ácido graso. Fundamentalmente también pueden usarse mezclas de solventes,
 - Vehículos como harinas minerales naturales (por ejemplo, caolina, arcillas, talco, tiza) y harinas minerales sintéticas (por ejemplo, ácido silícico altamente disperso, silicatos); emulsionantes como emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éter de polioxietileno alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo) y dispersantes como lejías residuales de lignina y metilcelulosa.

Como sustancias tensionactivas se toman para emplear las sales alcalinas, las sales alcalino-térreas, las sales de amonio de ácido lignosulfónico, ácidos naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalensulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres sulfatados de alcohol graso, además se consideran productos de condensación de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, productos de condensación de la naftalina o del ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, octilfenoléter de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, poliglicoléter de alquilfenol, poliglicoléter de tributilfenilo, poliglicoléter de tristearilfenilo, alcoholes de alquilarilpoliéter, condensados de alcohol y óxido de etileno alcohol graso, aceite de ricino etoxilado, alquiléter de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, acetal poliglicoléter de alcohol laurílico, éster de sorbitol, lejías de lignosulfito y metilcelulosa.

Para preparar soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, capaces de atomizarse directamente, se toman en cuenta las fracciones de aceite mineral con un punto de ebullición de medio a alto, como el queroseno o el aceite diesel, además aceites de alquitrán mineral así como los aceites de de origen vegetal o animal, los hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, solventes fuertemente polares como, por ejemplo, dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

Los polvos, los abrasivos y los productos para espolvorear pueden prepararse mezclando o moliendo las sustancias activas con un vehículo sólido.

Los granulados, por ejemplo los granulados para recubrimiento o impregnación y los granulados homogéneos pueden prepararse por unión de los principios activos con vehículos sólidos. Los vehículos sólidos son, por ejemplo, tierras minerales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, carbonato de calcio (attaclay), cal, tiza, bolus, loess, arcilla, dolomita, tierras diatomáceas, sulfato de calcio y de magnesio, óxido de magnesio, plásticos molidos, fertilizantes como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos vegetales, como harina de cereales, harina de corteza de árbol, de madera y de cáscaras de nueces, polvo de celulosa y otros vehículos sólidos.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,01 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,1 y 90 % en peso de la sustancia activa. Las sustancias activas se emplean en tal caso en una pureza de 90% hasta 100%, preferentemente 95% hasta 100% (según el espectro NMR).

Ejemplos de formulaciones son:

- 1. Productos para la dilución en agua
- 30 A Concentrados solubles en agua (SL, LS)

10 partes en peso de las sustancias activas se disuelven con 90 partes en peso de agua o un solvente soluble en agua. De manera alterna se agregan agentes humectantes u otros auxiliares. Al diluir en agua se disuelve la sustancia activa. De esta manera se obtiene una formulación con un contenido de 10 % en peso de sustancia activa.

B Concentrados capaces de dispersarse (DC)

20 partes en peso de las sustancias activas se disuelven en 70 partes en peson de ciclohexanona adicionando 10 partes en peso de un agente dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. Al diluir en agua resulta una dispersión. El contenido de sustancia activa es de 20 % en peso.

C Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de las sustancias activas se disuelven en 75 partes en peso de xileno adicionando sulfonato de Ca-dodecilbenceno y etoxilado de aceite de ricino (respectivamente 5 partes en peso). Al diluir en agua resulta una emulsión. La formulación tiene un contenido de 15 % en peso sustancia activa.

D Emulsiones (EW, EO, ES)

25 partes en peso de las sustancias activas se disuelven en 35 partes en peso de xileno adicionando sulfonato de Ca-dodecilbenceno y etoxilado de aceite de ricino (respectivamente 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce a

45 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsionante (por ejemplo Ultraturax) y se lleva a una emulsión homogénea. Al diluir en agua resulta una emulsión. La formulación tiene un contenido de sustancia activa de 25 % en peso.

E Suspensiones (SC, OD, FS)

20 partes en peso de las sustancias activas se trituran en un molino de bolas con agitador adicionando 10 partes en peso de agentes dispersantes y humectantes y 70 partes en peso de agua o un solvente orgánico para producir una suspensión de sustancia activa. Al diluir en agua resulta una suspensión estable de la sustancia activa. El contenido de sustancia activa en la formulación es de 20 % en peso.

F Granulados dispersables en agua e hidrosolubles (WG, SG)

50 partes en peso de las sustancias activas se muelen finamente adicionando 50 partes en peso de agentes dispersantes y humectantes y se preparan como granulados dispersables en agua o hidrosolubles por medio de equipos industriales (por ejemplo de extrusión, torres de aspersión, lecho fluidizado). En la dilución en agua resulta una dispersión estable o solución de la sustancia activa. La formulación tiene un contenido de sustancia activa de 50 % en peso.

G polvos dispersables en agua e hidrosolubles (WP, SP, SS, WS)

75 partes en peso de las sustancias activas se muelen en un molino rotor – estator adicionando 25 partes en peso de agentes dispersantes y humectantes así como gel de ácido silícico (sílice). En la dilución en agua resulta una dispersión estable o solución de la sustancia activa. El contenido de sustancia activa de la formulación es de 75 % en peso.

H Formulaciones de gel

10

15

20

30

35

En un molino de bolas se muelen 20 partes en peso de las sustancias activas, 10 partes en peso de dispersante, 1 parte en peso de agente gelificante y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para producir una suspensión fina. En la dilución con agua resulta una suspensión estable con 20 % en peso de contenido de sustancia activa.

2. Productos para la aplicación directa

I Polvos (DP, DS)

5 partes en peso de las sustancias activas se muelen finamente y se mezclan estrechamente con 95 partes en peso de caolina en partículas finas. De esta manera se obtiene un producto en forma de polvillo con un contenido de 5 % en peso de contenido de sustancia activa.

J Granulados (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de las sustancias activas se muelen finamente y se asocian con 99,5 partes en peso de un vehículo. En tal caso los métodos corrientes son la extrusión, el secameinto por aspersión o el lecho fluidificado. Se obtiene de esta manera un granulado para la aplicación directa con un contenido de 0,5 % en peso de sustancia activa.

K Soluciones ULV (UL)

10 partes en peso de las sustancias activas se disuelven en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo, xileno. De esta manera se obtiene un producto para la aplicación directa con contenido de 10 % en peso de sustancia activa.

Para el tratamiento de las semillas se utilizan usualmente concentrados solubles en agua (LS), suspensiones (FS), polvillos (DS), polvos dispersables en agua y solubles en agua (WS, SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y formulaciones en gel (GF). Estas formulaciones pueden utilizarse sobre las semillas sin diluir o, preferiblemente, diluidas. La aplicación puede efectuarse antes de la siembra.

40 Las sustancias activas pueden usarse como tales, en forma de sus formulaciones o formas de uso preparadas de las mismas, por ejemplo en forma de soluciones aspergibles directamente, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, agentes para espolvorear, agentes para esparcir, granulados por aspersión, nebulización, acción de espolvorear, de espacir o verter. Las formas de aplicación se rigen completamente por el propósito de uso; en cada caso deben garantizar la distribución más fina posible de las sustancias activas de acuerdo con la invención.

A partir de concentrados para emulsión, pastas o polvos humectables (polvos para asperger, dispersiones oleosas) mediante adición de agua pueden prepararse formas acuosas de aplicación. Para la preparación de emulsiones, pastas o dispersiones oleosas pueden homogeneizarse en agua las sustancias como tales o disueltas en un aceite o solvente, mediante un humectante, adherente, dispersante o emulsionante. Aunque también pueden prepararse concentrados compuestos a partir de sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante y eventualmente solvente o aceite, los cuales con adecuados para diluirse con agua.

Las concentraciones de sustancia activa en las preparaciones listas para aplicar pueden variar en rangos mayores. En general se encuentran entre 0,0001 y 10 %, preferentemente entre 0,01 y 1 %.

Las sustancias activas también pueden usarse con buen éxito en el método de Ultra-Low-Volume (ULV) o volumen ultra-bajo en cuyo caso es posible aplicar formulaciones con más de 95 % en peso de sustancia activa incluso la sustancia activa sin aditivos.

A las sustancias activas pueden agregarse aceites de tipos diferentes, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, bactericidas, opcionalmente también justo antes de la aplicación (mezclado en tanque). Estos agentes pueden adicionarse en mezcla a los productos de la invención en una relación de peso de 1 : 100 hasta 100 : 1, preferible 1 : 10 hasta 10 : 1.

Como adyuvantges en este sentido pueden considerarse: polisiloxanos modificados orgánicamente, por ejemplo Break Thru S 240®; alcoholes alcoxilados, por ejemplo Atplus 245®, Atplus MBA 1303®, Plurafac LF 300® y Lutensol ON 30®; polímeros en bloque EO-PO, por ejemplo Pluronic RPE 2035® y Genapol B®; alcoholes etoxilados, por ejemplo Lutensol XP 80®; y dioctilsulfosuccinato de sodio, por ejemplo Leofen RA®.

- 20 Los productos de acuerdo con la invención también pueden presentarse en la forma de aplicación como fungicidas junto con otras sustancias activas como, por ejemplo, con herbicidas, insecticidas, reguladores de crecimiento, fungicidasn o también con fertilizantes. Al mezclar los compuestos I o el producto que los contiene en la forma de aplicación como fungicidas con otros fungicidasn en muchos casos se obtiene un aumento del espectro de actividad fungicida.
- La siguiente lista de fungicidas con los que se pueden usar los compuestos según la invención debe explicar las posibilidades de combinación pero sin limitarlas:

Estrobilurinas

15

30

35

Azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, orisastrobina, éster metílico de ácido (2-cloro-5-[1-(3-metil-bencilooxiimino)-etil]-bencilo)-carbámico, éster metílico de ácido (2-cloro-5-[1-(6-metil-piridin-2-ilmetoxiimino)-etil]-bencilo)-carbámico, éster metílico de ácido 2-(orto-(2,5-dimetilfenil-oximetilen)fenil)-3-metoxi-acrílico;

Amidas de ácido carboxílico

- Anilidas de ácido carboxílico: benalaxilo, benodanilo, boscalida, carboxina, mepronilo, fenfuram, fenhexamida, flutolanilo, furametpir, metalaxilo, ofurace, oxadixilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida, tiadinilo, (4'-bromo-bifenil-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-carboxílico, (4'-trifluorometil-bifenil-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-carboxílico, (4'-cloro-3'-fluoro-bifenil-2-il)-amida de ácido 4-difluorometil-2-metil-tiazol-5-carboxílico, (3',4'-dicloro-4-fluoro-bifenil-2-il)-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-pirazol-4-carboxílico, (2-ciano-fenil)-amida de ácido 3,4-dicloro-isotiazol-5-carboxílico;
 - Morfolidas de ácido carboxílico: dimetomorf, flumorf;
- 40 Amidas de ácido benzoico: flumetover, fluopicolida (picobenzamida), zoxamide;
 - Otras amidas de ácido carboxílico: carpropamid, diclocimet, mandipropamida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenil)-etil)-2-metansulfonilamino-3-metil-butiramida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-iniloxi]-3-metoxi-fenil)-etil)-2-etansulfonilamino-3-metil-butiramida;

Azoles

- triazoles: bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluguinconazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimenol, triadimefona, triticonazol;

- Imidazoles: ciazofamida, imazalilo, pefurazoato, procloroaz, triflumizol;
- Benzimidazoles: benomilo, carbendazima, fuberidazol, tiabendazol;
- Otros: etaboxam, etridiazol, himexazol; compuestos heterocíclicos con contenido de nitrógeno.
- Piridinas: fluazinam, pirifenox, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina;
- 5 Pirimidinas: bupirimato, ciprodinilo, ferimzona, fenarimol, mepanipirim, nuarimol, pirimetanilo;
 - Piperazinas: triforina;
 - Pirroles: fludioxonilo, fenpiclonilo;
 - Morfolinas: aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf;
 - Dicarboximidas: iprodiona, procimidona, vinclozolina;
- otros: acibencenoar-S-metila, anilazina, captano, captafol, dazomet, diclomezina, fenoxanil, folpet, fenpropidina, famoxadona, fenamidona, octilinona, probenazol, proquinazid, piroquilona, quinoxifeno, triciclazol, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-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)-[1,2,4]triazol-1-sulfónico;

Carbamatos y ditiocarbamatos

- 15 Ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metiram, metam, propineb, tiram, zineb, ziram;
 - Carbamatos: dietofencarb, flubentiavalicarb, iprovalicarb, propamocarb, éster metílico de ácido 3-(4-cloro-fenil)-3-(2-isopropoxicarbonilamino-3-metil-butirilamino)-propiónico, éster (4-fluorofenílico) de ácido N-(1-(4-cianofenil)etansulfonil)-but-2-il) carbámico;

Otros fungicidas

- Guanidinas: dodina, iminoctadina, guazatina;
 - Antibióticos: kasugamicina, polioxina, estreptomicina, validamicina A;
 - compuestos organometélicos: sales de fentina;
 - compuestos heterocíclicos con contenido de azufre: isoprotiolano, ditianona;
- Compuestos organofosforados: edifenfos, fosetil, fosetilaluminio, iprobenfos, pirazofos, tolclofos-metilo, ácido fosforoso y sus sales;
 - Compuestos organoclorados: tiofanato metilo, clorootalonilo, diclofluanida, tolilfluanida, flusulfamida, ftalida, hexaclorobenceno, pencicurona, quintozeno;
 - Derivados de nitrofenilo: binapacrilo, dinocap, dinobutona;
- Sustancias activas inorgánicas: caldo de Bordeaux, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxicloruro de cobre,
 sulfato de cobre básico,

Azufre;

- Otros: espiroxamina, ciflufenamida, cimoxanilo, metrafenona.

Ejemplos de preparación:

Ejemplo 1: 5,6-Dietil-3-[6-(4-fluoro-fenil)-5-metil-piridin-2-il]-[1,2,4]-triazina

35 1) Preparación de hidrocloruro de 6-bromo-5-metilpiridin-2-carboxamidina

A 4,90 g (25 mmol) de 6-bromo-5-metilpiridin-2-carbonitrilo [para la preparación, véase US 2003/0087940 A1 y Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003)] en 60 ml de metanol se adicionaron 2,2 g de una solución al 30% de metilato de sodio en metanol y se revolvió por 7 horas a 23 °C. A continuación a esto se adicionaron 1,5 g de cloruro de amonio y se dejó revolviendo por otras 8 horas a 23 °C. Después de retirar el solvente se mezcló con éter terc-butílico de metilo (MtBE) y se filtró el producto por succión. Rendimiento: 4,2 g como sólido blanco que se siguió haciendo reaccionar sin purificación.

2) Preparación de 3-(6-bromo-5-metil-piridin-2-il)-5,6-dietil-[1,2,4]-triazina

A la solución de 10 g (40 mmol) del commpuesto preparado en el paso 1 en 100 ml de etanol se adicionaron 2,4 g (48 mmol) de hidróxido de hidrazinio. Después de 30 minutos se mezcló con 4,6 g (40 mmol) de 3,4-hexandiona, se revolvió por 5 horas bajo reflujo y se dejó reposar por 12 horas a 23 °C. A la solución de reacción se adicionó agua y n-pentano y se filtró por succión el producto obtenido. Rendimiento: 9,9 g de producto.

¹H-NMR (□, CDCl₃,): 1,4 (m); 2,5 (s); 2,9 (m); 3,1 (m); 7,7 (m) y 8,4 (m).

3) Preparación de 5,6-dietil-3-[6-(4-fluoro-fenil)-5-metil-piridin-2-il]-[1,2,4]-triazina

A la solución de 0,4 g del compuesto preparado en el paso 2 en 20 ml del éter dimetilo de etilenglicol se adicionaron sucesivamente 0,21 g de ácido 4-fluorofenilborónico, y 0,41 g de carbontato de sodio en 20 ml de agua. Después de adicionar cerca de 30 mg de dicloruro de [1,4-bis(difenilfosfino)butano]-paladio(II) se revolvió por 5 horas bajo reflujo. La solución de reacción se dividió después entre agua y MtBE. La fase orgánica se separó, se retiró el solvente y se cromatografió el residuo sobre gel de sílice con ciclohexano/MtBE (1:1). Se obtuvieron así 0,24 g de producto.

Fp. 108 °C

15

20

Ejemplo 2: 3-[6-(4-Fluorofenil)-5-metil-piridin-2-il]-5,6,7,8-tetrahidrobenzo-[1,2,4]-triazina

25 1) Preparación de 3-(6-bromo-5-metil-piridin-2-il)-5,6,7,8-tetrahidro-benzo-[1,2,4]-triazina

A una solución de 10 g de (40 mmol) clorhidrato de 6-bromo-5-metilpiridin-2-carboxamidina en 100 ml de etanol (EtOH) se adicionaron 2,4 g (48 mmol) de hidróxido de hidrazinio. Después de 30 minutos se mezcló con 4,5 g (40 mmol) de ciclohexan-1,2-diona y se revolvió por 7 horas bajo reflujo. La solución de reacción se dividió después entre agua y MtBE, se separó la fase orgánica, se retiró el solvente al vacío y se cromatografió el residuo sobre gel de sílice con ciclohexano/MtBE (1 : 1) y MtBE/EtOH (1 : 1). Rendimiento: 5,5 g de producto.

¹H-NMR (□, CDCl₃,): 1,9 (m); 2,5 (s); 2,8 (m); 3,1 (m); 3,2 (m); 7,7 (m) y 8,45 (m).

2) Preparación de 3-[6-(4-fluorofenil)-5-metil-piridin-2-il]-5,6,7,8-tetrahidrobenzo-[1,2,4]-triazina

A la solución de 0,4 g del compuesto preparado en paso 1 en 20 ml de éter dimetílico de etilenglicol se adicionaron sucesivamente 0,22 g de ácido 4-fluorofenilborónico y 0,41 g de carbonato de sodio en 20 ml de agua. Después de adicionar cerca de 30 mg de dicloruro de [1,4-bis(difenilfosfino)butan]-paladio(II) se revolvió por 5 horas bajo reflujo. Después se dividió la solución de reacción entre agua y MtBE. La fase orgánica se separó, el solvente se retiró al vació y el residuo se cromatografió sobre gel de sílice con ciclohexano/MtBE (1:1). Así se obtuvieron 0,13 g de producto.

Fp. 105 °C

5

De manera análoga se prepararon los compuestos de la fórmula general I descritos en la tabla 1:

Tabla 1:

No.	R⁵	R⁴	R ³	R ¹	R²	Datos físicos (°C)/
						[M+H] ⁺
1	4-Fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	108
2	4-Fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH2CH ₂	CH ₂ CH ₂	105
3	4-Fluoro-fenilo	Н	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	112-115
4	Fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	70-73
5	4-Fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₃	CH ₃	151-154
6	Fenilo	CH ₃	Н	CH ₃	CH ₃	193-196
7	3,4-Difluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH₃	CH₃	139-142

No.	R ⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Datos físicos (°C)/
						[M+H] ⁺
8	3,4,5-Trifluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₃	CH ₃	169
9	3,5-Difluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₃	CH ₃	158
10	3-Cloro-4-fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₃	CH ₃	120
11	3-Metil-4-fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₃	CH ₃	154
12	4-Cloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	133-137
13	4-Metil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	128-130
14	4-Metoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH3	CH ₂ CH ₃	118-120
15	4-Ciano-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	171-173
16	4-Formil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	122-124
17	4-tertButil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	97-101
18	4-iso-Propil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	100-103
19	4-Trifluormetil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	131-137
20	2-Cloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	103-106
21	2-Fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	129-132
22	2-Metil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	114-120
23	2,4-Difluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	142-144
24	3-Cloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	95-98
25	3-Metil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	61-64
26	3-Metoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	Aceite
27	4-Acetil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	124-126
28	4-Etoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	103-107
29	3,4-Dimetoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	99-102
30	3,5-Dicloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	146-148
31	Fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	161
32	4-Fluoro-fenilo	Н	Н	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	140-143
33	3-Cloro-4-fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH3	124-128
34	4-Fenoxifenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	125-128

No.	R⁵	R⁴	R ³	R ¹	R ²	Datos físicos (°C)/
						[M+H] ⁺
35	4-Tiometil-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	123-126
36	3,4-Dicloro-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	145-148
37	3-Cloro-4-metoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	127-130
38	3-Fluoro-4-etoxi-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	96-99
39	3,5-Dimetil-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 333
40	3-Cloro-4-iso-propoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 397
41	3-Cloro-4-etoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	116-119
42	2-Metoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	97-100
43	3-Fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 323
44	3-Etoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	89-92
45	3-Fluoro-4-metoxi	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	117-120
46	3,4-Difluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH₂CH₃	CH ₂ CH ₃	121-124
47	4-Etil-fenilo	CH ₃	Н	CH₂CH₃	CH ₂ CH ₃	102-106
48	3,5-Difluoro-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	111-113
49	3-Isopropoxi-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H:363,2
50	2,3-Difluoro-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-117
51	2,5-Difluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-118
52	2,5-Dicloro-fenilo	CH₃	Н	CH₂CH₃	CH₂CH₃	117-120
53	3-Metil-4-fluoro-fenilo	CH₃	Н	CH₂CH₃	CH₂CH₃	92-95
54	2,4-Dimetoxi-fenilo	CH₃	Н	CH₂CH₃	CH₂CH₃	M+H:365,2
55	2,3-Dimetil-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	125-130
56	2,5-Dimetil-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 333,2
57	2-Etoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH₂CH₃	CH ₂ CH ₃	89-96
58	4-Trifluormetoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH₂CH₃	CH ₂ CH ₃	113-117
59	3,4,5-Trifluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH₂CH₃	CH ₂ CH ₃	157-160
60	4-n-Propoxi-fenilo	CH₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-115
61	3-Fluoro-4-metil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	119-122

No.	R⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Datos físicos (°C)/
						[M+H] ⁺
62	4-iso-Propoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	91-95
63	4-n-Butoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H:377,2
64	4-Cloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		165-168
65	2-Cloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		175-178
66	2-Metil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		156-159
67	2,4-Difluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		142-145
68	2,4-Dicloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		173-176
69	4-Metoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		159-163
70	2-Metoxi-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		144-147
71	2-Fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		148-152
72	2,3-Dimetil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		142-145
73	2-Etil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		140-142
74	2-Trifluormetil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		163-166
75	4-Trifluormetil-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		155-158
76	2-Metil-4-fluoro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H:337,3
77	3-Metil-4-metoxi	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	101-108
78	3-Metil-4-cloro-fenilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	105-109
79	Tiofen-2-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	141-144
80	4-Metil-tiofen-3-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	98-102
81	6-Fluoro-piridin-3-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	126-129
82	Piridin-3-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃	93-97
83	6-Metoxi-piridin-3-ilo	CH3	Н	CH2CH3	CH2CH3	113-117
84	2-Cloro-piridin-3-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	93-99
85	6-Cloro-piridin-3-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	143-147
86	Piridin-4-ilo	CH ₃	Н	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	127-130
	1	i .			1	

Ensayo de la actividad fungicida:

Las sustancias activas se prepararon separadas o juntas como una solución madre con 25 mg de sustancia activa que se completó con una mezcla de acetona y/o dimetilsulfóxido (DMSO) y el emulsionante Wettol® EM 31 (humectante con actividad de emulsionante y dispersante a base de alquilfenoles etoxilados) en una proporción de

ES 2 358 615 T3

volumen solvente – emulsionante de 99 a 1 hasta 10 ml. A continuación se completó hasta 100 ml con agua. Esta solución madre se diluyó con la mezcla descrita de solvente-emulsionante –agua hasta la concentración indicada de sustancia activa.

Ejemplo de aplicación 1- efectividad contra la enfermedad de alternariosis del tomate causada por Alternaria solani

Las hojas de plantas de tomates en maceta se rociaron con una suspensión acuosa en la concentración de sustancia activa indicada abajo hasta que se empaparon. Al día siguiente las plantas tratadas se inocularon con una suspensión de esporas de Alternaria solani que contenía 0,17 x 10⁶ esporas/ml en una solución acuosa de biomalta al 2%. A continuación las plantas de ensayo se colocaron en una cámara saturada con vapor de agua a temperaturas de 20 hasta 22 °C. Después de 5 días la enfermedad se habpia desarrollado tan fuerte sobre las plantas de control infectadas, no tratadas, que la infestación de todas las plantas podía determinarse visualmente en %.

En este ensayo las plantas tratadas con 250 ppm de las sustancias activas de los ejemplos 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 33 mostraron máximo una infestación de 5 %, mientras que las plantas no tratadas se infestaron hasta 90%.

Ejemplo de aplicación 2 – Efectividad contra podredumbre gris en hojas de pimentón causada por Botrytis cinerea en el caso de aplicación protectora de 1 día

Se rociaron hasta empaparse hojas de pimentón de la especie "Neusiedler Ideal Elite", después de que se habían desarrollado bien 2 a 3 hojas, con una suspensión acuosa en la concentración de sustancia activa indicada abajo. Al siguiente día, se inocularon las plantas tratadas con una suspensión de esporas de Botrytis cinérea que contenía 1,7 x 10⁶ de esporas/ml en una solución acuosa de biomalta al 2%. A continuación, las plantas de ensayo se colocaron en una cámara climática a temperaturas entre 22 y 24 °C, oscuridad y alta humedad del aire. Después de 5 días se determinó visualmente en % la dimensión de la infestación de hongos sobre las hojas.

En este ensayo las plantas tratadas con 250 ppm de las sustancias activas de los ejemplosn 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 31 ó 33 mostraron máximo una infestación de 10 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infestadas hasta un 90 %.

25 Ejemplo de aplicación 3 – Efectividad frente a la enfermedad de manchas de la malla en la cebada causada por Pirenophora teres en el caso de 1 día de aplicación protectora.

Se rociaron hasta empaparse hojas de gérmenes de cebada crecidos en macetas con una suspensión acuosa en la concentración de sustancia activa indicada abajo. 24 horas después de secar la capa de rocío, las plantas de ensayo se inocularon con una suspensión acuosa de esporas de Pirenophora [syn. Drechslera] teres, el agente patógeno de la enfermedad de manchas de malla. Después se colocaron las plantas de ensayo en un invernadero a temperaturas entre 20 y 24 °C y 95 hasta 100 % de humedad relativa del aire. Después de 6 días la dimensión del desarrollo de la enfermedad se determinó visualmente en % de la infestación de la superficie total de la hoja.

En este ensayo, las plantas tratadas con 250 ppm de la sustancia activa del ejemplo 31 tenía una infestación máxima del 10 %, mientras que las plantas no tratadas estaban infestadas hasta un 90 %.

35

30

20

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazina de la fórmula general I

$$R^4$$
 R^5
 N
 N
 R^1
 R^2
(I)

5 en la que:

10

20

25

 R^1 , R^2 representan independientemente uno de otro OH, halógeno, NO_2 , NH_2 , alquilo de C_1 - C_8 , alcoxi de C_1 - C_8 , haloalquilo de C_1 - C_8 , haloalcoxi de C_1 - C_8 , alquilamino de C_1 - C_8 o di(alquil de C_1 - C_8)amina, o conjuntamente con los átomos de C_1 que están enlazados, pueden formar un carbociclo o heterociclo saturado de C_1 - C_1 0 o de carbono del anillo uno o dos heteroátomos seleccionados entre oxígeno y azufre como miembros de anillo, en cuyo caso el carbociclo y el heterociclo están sin sustituir o tienen C_1 0, C_2 1 o de grupos alquilo de C_1 - C_2 2 como sustituyentes;

 R^3 representa hidrógeno, alquilo de C_1 - C_4 , alcoxi de C_1 - C_4 , haloalquilo de C_1 - C_4 , haloalquilo de C_3 - C_6 , cicloalquilmetilo de C_3 - C_6 o halógeno;

R⁴ representa hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄ o halógeno;

R⁵ representa alquilo de C₁-C₈, haloalquilo de C₁-C₈, alcoxi de C₁-C₈, haloalcoxi de C₁-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalquil(de C₃-C₈)oxi, heteroarilo de de 5 ó 6 miembros, fenilo, fenoxi, bencilo, benciloxi, heteroarilmetilo de 5 ó 6 miembros o heteroariloxi de 5 ó 6 miembros, en cuyo caso

Los residuos cíclicos nombrados previamente están sin sustituir o pueden tener 1, 2, 3, 4 ó 5 residuos R^a , en cuyo caso R^a se selecciona entre OH, SH, halógeno, NO₂, NH₂, CN, COOH, alquilo de C₁-C₈, alcoxi de C₁-C₈, haloalquilo de C₁-C₈, haloalcoxi de C₁-C₈, alquilamino de C₁-C₈, di(alquil de C₁-C₈)amina, alquil(de C₁-C₈)tio, haloalquil(de C₁-C₈)sulfinilo, haloalquil(de C₁-C₈)sulfinilo, alquil(de C₁-C₈)sulfonilo, haloalquil(de C₁-C₈)sulfonilo, cicloalquilo de C₃-C₈, fenilo, fenoxi y residuos de la fórmula C(=Z)R^{aa}, donde Z representa O, S, N(alquilo de C₁-C₈), N(alcoxi de C₁-C₈), N(alqueniloxi de C₃-C₈) o N(alquiniloxi de C₃-C₈) y R^{aa} significa hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alcoxi de C₁-C₈, NH₂, alquilamino de C₁-C₈ o di(alquil de C₁-C₈)amino, o dos residuos R^a enlazados con átomos de C adyacentes también pueden formar conjuntamente con los átomos de C, con los que están enlazados, un carbociclo saturado de 5, 6 ó 7 miembros, un anillo de benceno o un heterociclo de 5, 6 ó 7 miembros, el cual tiene como miembros de anillo, además de los carbonos miembros de anillo, uno o dos heteroátomos seleccionados entre oxígeno y azufre, en cuyo caso el carbociclo y el heterociclo están sin sustituir o tienen 1, 2, 3 ó 4 grupos alquilo de C₁-C₄ como sustituyentes;

30 y las sales útiles en la agricultura de los compuestos de la fórmula I, a excepción de:

2,6-Bis-(5,6-dimetil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-dietil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-dipropil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-diisopropil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

35 2,6-Bis-(5,6-dibutil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-diisobutil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-dipentil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-dihexil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

2,6-Bis-(5,6-diheptil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;

3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dimetil-1,2,4-triazina;

3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dietil-1,2,4-triazina;

5 3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dipropil-1,2,4-triazina;

3-[6-(2,2'-bipiridil)]-5,6-dibutil-1,2,4-triazina;

5,6-Dietil-3-[6-(2-piridil)-4-metoxipiridin-2-il]-1,2,4-triazina;

3-(6-Metilpiridin-2-il)-5,6-dimetil-1,2,4-triazina;

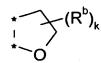
3-(6-Metilpiridin-2-il)-5,6-dietil-1,2,4-triazina;

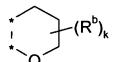
10 2,6-Bis-(5,6-dimetoxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina; y

2,6-Bis-(5,6-dietoxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina.

- **2.** Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en la que R^1 y R^2 se seleccionan independientemente uno de otro de entre flúor, cloro, alquilo de C_1 - C_4 , metoxi, etoxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 y $OCHF_2$.
- **3.** Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹ y R², en conjunto con los átomos de C del anillo de triazina a los que están enlazados, representan uno de los siguientes anillos:







$$(R^b)_i$$

donde

* designa los átomos del anillo de triazina;

k significa 0, 1, 2, 3 ó 4;

20 R^b representa alquilo de C₁-C₄; y

X representa $(CH_2)_n$ con n = 1, 2 ó 3 y en cuyo caso, cuando $k \ne 0$, entonces 1, 2, 3 ó 4 de los átomos de hidrógeno en $(CH_2)_n$ pueden estar reemplazados por R^b .

4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹ y R² representan alquilo de C₁-C₄ o conjuntamente con los átomos de C del anillo de triazina con los que están enlazados representan un anillo de la fórmula

donde

* designa los átomos del anillo de triazina;

k significa 0, 1, 2, 3 ó 4 bedeutet;

R^b representa alquilo de C₁-C₄: v

- 5 X representa (CH₂)_n con n = 2 ó 3 y en cuyo caso, cuando k es ≠ 0, entonces 1, 2, 3 ó 4 de los átomos de hidrógeno pueden estar reemplazados en (CH₂)_n por R^b.
 - **5.** Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, donde R³ representa hidrógeno, flúor, cloro, alquilo de C₁-C₄, metoxi, etoxi, CF₃, CHF₂, OCF₃ o OCHF₂.
- **6.** Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, donde R⁴ representa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo, metoxi, etoxi, CF₃, CHF₂, OCF₃ o OCHF₂.
 - 7. Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, donde R^a se selecciona de entre halógeno, alquilo de C_1 - C_4 , alcoxi de C_1 - C_4 , alquil(de C_1 - C_4)carbonilo, alcoxi(de C_1 - C_4)carbonilo, y residuosn de la fórmula C(=N-O-alquilo de C_1 - C_8) R^{aa} , donde

R^{aa} representa hidrógeno o alquilo de C₁-C₄.

- 8. Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, donde R⁵ representa fenilo, fenoxi o bencilo, donde el anillo de fenilo tiene 1, 2, 3, 4 ó 5 residuos R^a.
 - 9. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 8, donde el anillo de fenilo en el fenilo, fenoxi o bencilo tiene la fórmula general P

$$R^{12}$$
 R^{13}
 R^{14}
 R^{15}
 R^{15}

20 donde # significa el punto de enlace con el residuo de la molécula;

R¹¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, CH₃, OCH₃, OCH₅, OCF₃ o CF₃;

R¹², R¹⁴ significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, cloro, flúor, CH₃, OCH₃, OCHF₂, OCF₃ o CF₃,

En cuyo caso uno de los residuos R¹² y R¹⁴ también pueden representar NO₂, C(O)CH₃ o COOCH₃;

R¹³ representa hidrógeno, flúor, cloro, ciano, OH, CHO, NO₂, NH₂, metilamino, di- metilamino, dietilamino, alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₈, alcoxi de C₁-C₄, alquil(de C₁-C₄)tio, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, CO(A²), donde A² representa alquilo de C₁-C₄ o alcoxi de C₁-C₄, o un grupo C(R^{13a})=NOR^{13b}, donde R^{13a} representa hidrógeno o metilo y R^{13b} representa alquilo de C₁-C₄, propargilo o alilo, o R¹² y R¹³ forman en conjunto un grupo O- CH₂-O; y

R¹⁵ significa hidrógeno, flúor, cloro o alquilo de C₁-C₄.

35

sustituyentes Ra.

- 30 10. Compuestos según una de las reivindicaciones 1 hasta 7, donde R⁵ representa alquilo de C₁-C₆ o haloalquilo de C₁-C₆.
 - **11.** Compuestos según una de las reivindicaciones 1 hasta 7, donde R⁵ se selecciona entre heteroarilo de 5 miembros, el cual tiene 1, 2, 3 ó 4 átomos de nitrógeno o 1 heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre y opcionalmente 1, 2 ó 3 átomos de nitrógeno como átomos de anillo, y hetarilo de 6 miembros que tiene 1, 2, 3 ó 4 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, en cuyo caso hetarilos de 5 y de 6 miembros pueden tener 1, 2, 3 ó 4

- **12.** Uso de compuestos de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 hasta 11 y de sus sales para controlar hongos fitopatogénicos.
- **13.** Producto para proteger plantas que contiene un vehículo sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 hasta 11 y/o una sal del mismo.
- 5 **14.** Semillas que contienen al menos un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 hasta 11 y/o una sal del mismo.
 - **15.** Método para controlar hongos fitopatogénicos **caracterizado porque** se tratan los hongos o los materiales, las plantas, el suelo o las semillas a proteger de la infestación de hongos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I según una de las reivindicaciones 1 hasta 11 o con una sal del mismo.

10