



(19)
Bundesrepublik Deutschland
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 602 01 089 T2 2004.12.30**

(12)

Übersetzung der europäischen Patentschrift

(97) **EP 1 381 610 B1**

(21) Deutsches Aktenzeichen: **602 01 089.6**

(86) PCT-Aktenzeichen: **PCT/EP02/03830**

(96) Europäisches Aktenzeichen: **02 727 534.6**

(87) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: **WO 02/083677**

(86) PCT-Anmeldetag: **06.04.2002**

(87) Veröffentlichungstag

der PCT-Anmeldung: **24.10.2002**

(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: **21.01.2004**

(97) Veröffentlichungstag

der Patenterteilung beim EPA: **25.08.2004**

(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: **30.12.2004**

(51) Int Cl.⁷: **C07D 487/04**
A01N 43/90

(30) Unionspriorität:

01109010 11.04.2001 EP

(73) Patentinhaber:

BASF AG, 67063 Ludwigshafen, DE

(84) Benannte Vertragsstaaten:

**AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LI, LU, MC, NL, PT, SE, TR**

(72) Erfinder:

**TORMO I BLASCO, Jordi, 69514 Laudendach, DE;
SAUTER, Hubert, 68167 Mannheim, DE; MÜLLER,
Bernd, 67227 Frankenthal, DE; GEWEHR, Markus,
56288 Kastellaun, DE; GRAMMENOS, Wassilios,
67071 Ludwigshafen, DE; GROTE, Thomas, 67157
Wachenheim, DE; GYPSE, Andreas, 68159
Mannheim, DE; RHEINHEIMER, Joachim, 67063
Ludwigshafen, DE; ROSE, Ingo, 68159 Mannheim,
DE; SCHÄFER, Peter, 67308 Ottersheim, DE;
SCHIEWECK, Frank, 67258 Hessheim, DE;
AMMERMAN, Eberhard, 64646 Heppenheim, DE;
STRATHMANN, Siegfried, 67117 Limburgerhof,
DE; LORENZ, Gisela, 67434 Hambach, DE;
STIERL, Reinhard, 67251 Freinsheim, DE**

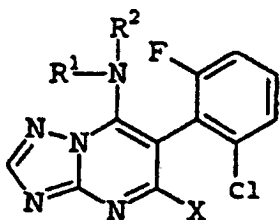
(54) Bezeichnung: **6-(2-CHLOR-6-FLUOR-PHENYL)-TRIAZOLPYRIMIDINE**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patent- und Markenamt inhaltlich nicht geprüft.

Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft 6-(2-Chlorfluorphenyl)triazolopyrimidine der Formel I



I

in der

R¹ und R² unabhängig Wasserstoff oder

C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₄-C₁₀-Alkadienyl oder C₁-C₁₀-Halogenalkyl,

C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₁₀-Bicycloalkyl, Phenyl, Naphthyl oder 5- oder 6-gliedriges Heterocycl, das ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält, oder

5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, das ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält,

bedeuten, oder

wo die R¹- und R²-Reste unsubstituiert oder teilweise oder ganz halogeniert sein können oder eine bis drei Gruppen R^a,

wobei R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Alkinyloxy und C₁-C₄-Alkylendioxy, das halogeniert sein kann, bedeutet,

tragen können, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem dazwischenliegenden Stickstoffatom einen 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Ring, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält und der durch ein bis drei R^a-Reste substituiert sein kann, bedeuten;

X Cyano, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₈-Alkenyloxy bedeutet.

[0002] Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Zusammensetzungen sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von phytopathogenen Pilzen.

[0003] In EP-A 071 792 werden 6-Phenyl-7-aminotriazolopyrimidine offenbart, bei denen die 5-Stellung durch Wasserstoff oder Alkyl- oder Arylgruppen substituiert ist.

[0004] EP-A 550 113 betrifft 5-H- und 5-Halogen-6-phenyl-7-aminotriazolopyrimidine, bei denen die 7-Aminogruppe weiter substituiert ist.

[0005] In WO-A 98/46607 werden Triazolopyrimidine offenbart, die in der 6-Stellung durch eine 2,4,6-Trifluorphenylgruppe substituiert sind.

[0006] In US 5 994 360 werden Triazolopyrimidine offenbart, die in der 5-Stellung durch Alkylgruppen substituiert sind.

[0007] Von den in den obenerwähnten Dokumenten offenbarten Verbindungen wird behauptet, daß sie gegen verschiedene phytopathogene Pilze wirksam sind.

[0008] Es ist Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Verbindungen mit verbesserter fungizider Wirkung bereitzustellen.

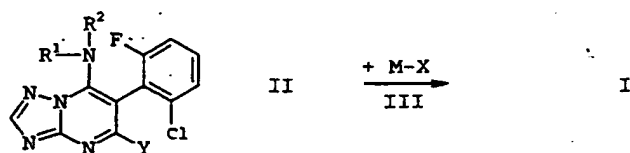
[0009] Es wurde gefunden, daß diese Aufgabe durch die eingangs definierten Verbindungen gelöst wird. Weiterhin wurden Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Zusammensetzungen und Verfahren zur Bekämpfung von phytopathogenen Pilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

[0010] Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den obengenannten Schritten bekannten Verbindungen durch die Kombination der 2-Chlor-6-fluorphenylgruppe sowie der speziellen Substitution in der 5-Stellung des Triazolopyrimidinsystems.

[0011] Bei einer 4- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Gruppe kann es sich um eine beliebige heterocyclische

Gruppe mit 4 bis 6 Ringatomen, unterbrochen durch ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus Schwefel, Stickstoff und Sauerstoff, vorzugsweise Sauerstoff, handeln. Mit „Halogenatom“ wird geeigneterweise ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom bezeichnet.

[0012] Mit der vorliegenden Erfindung wird weiterhin ein Verfahren zur Herstellung von wie oben definierten Verbindungen der Formel I bereitgestellt, bei dem man eine 5-Halogenverbindung der Formel II



in welcher Y für Halogen steht, mit einer Verbindung der Formel III, bei der es sich abhängig von dem Wert von X, der eingeführt werden soll, so daß man eine Verbindung der Formel I erhält, um ein anorganisches Cyano-salz, ein Alkoxylat, Halogenalkoxylat bzw. ein Alkenyloxylat handelt, behandelt, vorzugsweise in Gegenwart eines Lösungsmittels. Das Kation M in Formel III hat einen relativ geringen Einfluß; aus praktischen und ökonomischen Erwägungen werden normalerweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- und Erdalkalisalze bevorzugt.

[0013] Als Lösungsmittel eignen sich Ether wie Dioxan, Diethylether und insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, beispielsweise Toluol.

[0014] Die Umsetzung wird geeigneterweise bei einer Temperatur im Bereich von 0°C bis 120°C durchgeführt, wobei die bevorzugte Reaktionstemperatur 10°C bis 40°C beträgt.

[0015] Weiterhin wird die Umsetzung vorzugsweise in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als Basen eignen sich tertiäre Amine wie Triethylamin und anorganische Basen wie Kaliumcarbonat oder Natriumcarbonat. Alternativ dazu kann ein Überschuß der Verbindung der Formel III als Base dienen.

[0016] Die Reaktionsmischungen werden in üblicher Weise aufgearbeitet, beispielsweise durch Mischen mit Wasser, Phasentrennung und, falls erforderlich, chromatographische Aufreinigung der Rohprodukte. Die Endprodukte fallen zum Teil in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhten Temperaturen von flüchtigen Anteilen befreit bzw. gereinigt werden. Werden die Endprodukte als Feststoffe erhalten, so kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

[0017] Die Verbindungen der Formel II sind im Stand der Technik bekannt und lassen sich durch in EP-A 550 113 und WO-A 98/46608 offenbarte Synthesewege erhalten.

[0018] Sind einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich, so können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I dargestellt werden.

[0019] Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein für die folgenden Substituenten stehen:

- Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Iod;
- C₁-C₁₀-Alkyl und die Alkylteile von C₁-C₁₀-Halogenalkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 10, insbesondere 1 bis 6, Kohlenstoffatomen, beispielsweise C₁-C₄-Alkyl wie oben erwähnt oder Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;
- C₁-C₆-Halogenalkyl und die Halogenalkylteile von C₁-C₆-Halogenalkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6, vorzugsweise 1 bis 4, Kohlenstoffatomen (wie oben erwähnt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig durch Halogenatome wie oben erwähnt ersetzt sein können, beispielsweise C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;
- C₃-C₁₀-Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 10, insbeson-

dere 3 bis 6, Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, beispielsweise 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl und 2-Methyl-2-propenyl;

– C₂-C₁₀-Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10, insbesondere 2 bis 4, Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, beispielsweise Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl und 1-Methyl-2-propinyl.

– Allgemein ausgedrückt wird mit dem hier in bezug auf einen Rest bzw. einen Teil verwendeten Ausdruck „Cycloalkyl“ eine Cycloalkylgruppe mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, vorzugsweise 5 bis 7 Kohlenstoffatomen, bezeichnet.

– Allgemein ausgedrückt wird mit dem hier in bezug auf einen Rest oder einen Teil verwendeten Ausdruck „Bicycloalkyl“ eine Bicycloalkylgruppe mit 5 bis 10 Kohlenstoffatomen, vorzugsweise 6 bis 9 Kohlenstoffatomen, insbesondere Bicycloheptyl, gegebenenfalls substituiert durch ein oder mehrere Halogenatome, Nitro, Cyano, Alkyl, vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl, Alkoxy, vorzugsweise C₁-C₆-Alkoxy, bezeichnet.

– 5-gliedriges Heteroaryl mit einem bis vier Stickstoffatomen oder einem bis drei Stickstoffatomen und einem Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-gliedrige Heteroarylgruppen, die zusätzlich zu Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, beispielsweise 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isotiazolyl, 4-Isotiazolyl, 5-Isotiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;

– 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis vier Stickstoffatomen: 6-gliedrige Heteroarylgruppen, die zusätzlich zu Kohlenstoffatomen ein bis drei oder ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, beispielsweise 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl.

[0020] Im Hinblick auf ihre beabsichtigte Verwendung werden die Triazolopyrimidine der Formel I bevorzugt, die die folgenden Substituenten aufweisen, wobei die Bevorzugung jeweils für sich alleine oder in Kombination gilt:

[0021] Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte hinsichtlich der Variablen entsprechen denen der Reste X, R¹ und R² von Formel I.

[0022] Eine bevorzugte Alkyleinheit ist eine Ethyl- oder insbesondere eine Methylgruppe.

[0023] Eine bevorzugte Halogenalkyleinheit ist die 2,2,2-Trifluorethyl- oder 1,1,1-Trifluorprop-2-ylgruppe.

[0024] Eine bevorzugte Alkenyleinheit ist Allyl oder insbesondere eine 2-Methylallylgruppe.

[0025] Eine bevorzugte Cycloalkyleinheit ist Cyclopentyl, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Halogenatome, Nitro, Cyano, Alkyl, vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl, Alkoxy, vorzugsweise C₁-C₆-Alkoxy, substituiert ist.

[0026] Eine bevorzugte Heteroaryleinheit ist Pyridyl, Pyrimidyl, Pyrazolyl oder Thienyl.

[0027] Bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, in denen die Alkyl- bzw. Halogenalkylteile der Gruppen R¹ bzw. R², die geradkettig oder verzweigt sein können, bis zu 10 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 1 bis 9 Kohlenstoffatome, besonders bevorzugt 2 bis 6 Kohlenstoffatome, enthalten, die Alkenyl- bzw. Alkynylteile der Substituenten R¹ bzw. R² bis zu 10 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 2 bis 9 Kohlenstoffatome, besonders bevorzugt 3 bis 6 Kohlenstoffatome, enthalten, die Cycloalkylteile der Substituenten R¹ bzw. R² 3 bis 10 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 3 bis 8 Kohlenstoffatome, besonders bevorzugt 3 bis 6 Kohlenstoffatome, enthalten und die Bicycloalkylteile der Substituenten R¹ bzw. R² 5 bis 9 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 7 bis 9 Kohlenstoffatome, enthalten. Alkyl-, Alkenyl- und Alkynylgruppen können jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

[0028] Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, in denen R¹ nicht für Wasserstoff steht.

[0029] Bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, insbesondere eine verzweigte C₃-C₁₀-Alkylgruppe, eine C₃-C₈-Cycloalkyl-, eine C₅-C₉-Bicycloalkyl-, eine C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl-, eine C₁-C₁₀-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl-, eine C₁-C₁₀-Halogenalkyl- oder eine Phenylgruppe steht, gegebenenfalls substituiert durch ein bis drei Halogenatome oder C₁-C₁₀-Alkyl- oder C₁-C₁₀-Alkoxygruppen.

[0030] Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^2 für ein Wasserstoffatom oder eine C_1 - C_{10} -Alkyl- oder eine C_1 - C_{10} -Halogenalkylgruppe, insbesondere ein Wasserstoffatom, steht.

[0031] Daneben sind die Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^2 für Wasserstoff steht.

[0032] Außerdem sind die Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^2 für Methyl steht.

[0033] Besonders bevorzugt sind weiterhin die Verbindungen I, in denen R^2 für Ethyl steht.

[0034] Steht R^1 für eine C_1 - C_{10} -Halogenalkylgruppe, vorzugsweise eine polyfluorierte Alkylgruppe, insbesondere eine 2,2,2-Trifluorethyl-, eine 2-(1,1,1-Trifluorpropyl)- oder eine 2-(1,1,1-Trifluorbutyl)gruppe, so steht R^2 vorzugsweise für ein Wasserstoffatom.

[0035] Steht R^1 für eine gegebenenfalls substituierte C_3 - C_8 -Cycloalkylgruppe, vorzugsweise eine Cyclopentyl- oder Cyclohexylgruppe, so steht R^2 vorzugsweise für ein Wasserstoffatom oder eine C_1 - C_6 -Alkylgruppe.

[0036] Besonders bevorzugt sind außerdem die Verbindungen I, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem dazwischen befindlichen Stickstoffatom einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring, vorzugsweise einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen C_3 - C_7 -Ring, insbesondere einen Pyrrolidin-, Piperidin-, Tetrahydropyridin-, insbesondere 1,2,3,6-Tetrahydropyridin-, oder Azepanring bilden, der gegebenenfalls durch eine oder mehrere C_1 - C_{10} -Alkylgruppen substituiert ist.

[0037] Der Schutzbereich der vorliegenden Erfindung umfaßt (R)- und (S)-Isomere der Verbindungen der allgemeinen Formel I mit Chiralitätszentrum und deren Racemate und Salze, N-Oxide und Säureadditionsverbindungen.

[0038] Im Hinblick auf ihre Verwendung besonders bevorzugt sind die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausführungsform der betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

[0039] Verbindungen der Formel I, in denen X für Cyano steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 2

[0040] Verbindungen der Formel I, in denen X für Methoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 3

[0041] Verbindungen der Formel I, in denen X für Ethoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 4

[0042] Verbindungen der Formel I, in denen X für n-Propoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 5

[0043] Verbindungen der Formel I, in denen X für Isopropoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 6

[0044] Verbindungen der Formel I, in denen X für Allyloxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 7

[0045] Verbindungen der Formel I, in denen X für Methylallyloxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 8

[0046] Verbindungen der Formel I, in denen X für Fluormethoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

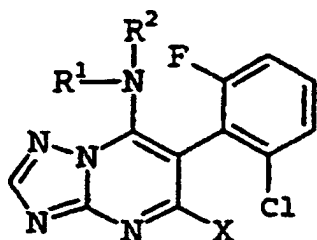
Tabelle 9

[0047] Verbindungen der Formel I, in denen X für Difluormethoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle 10

[0048] Verbindungen der Formel I, in denen X für Trifluormethoxy steht und R^1 und R^2 einer Zeile der Tabelle A entsprechen

Tabelle A



Nr.	R ¹	R ²
A-1	CH ₂ CH ₃	H
A-2	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₂ CF ₃	H
A-5	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-6	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₂ CCl ₃	H
A-8	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-9	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-10	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-14	CH(CH ₃) ₂	H
A-15	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-16	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-17	(±) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	H
A-18	(±) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-19	(±) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-20	(R) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	H
A-21	(R) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-22	(R) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-23	(S) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	H
A-24	(S) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-25	(S) CH(CH ₃) - CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-26	(±) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	H
A-27	(±) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-28	(±) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29	(R) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	H
A-30	(R) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-31	(R) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-32	(S) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	H
A-33	(S) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-34	(S) CH(CH ₃) - CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-35	(±) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	H
A-36	(±) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-37	(±) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-38	(R) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	H
A-39	(R) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-40	(R) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-41	(S) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	H
A-42	(S) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-43	(S) CH(CH ₃) - C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-44	(±) CH(CH ₃) - CF ₃	H
A-45	(±) CH(CH ₃) - CF ₃	CH ₃
A-46	(±) CH(CH ₃) - CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-47	(R) CH(CH ₃) - CF ₃	H
A-48	(R) CH(CH ₃) - CF ₃	CH ₃
A-49	(R) CH(CH ₃) - CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-50	(S) CH(CH ₃) - CF ₃	H
A-51	(S) CH(CH ₃) - CF ₃	CH ₃
A-52	(S) CH(CH ₃) - CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-53	(±) CH(CH ₃) - CCl ₃	H
A-54	(±) CH(CH ₃) - CCl ₃	CH ₃
A-55	(±) CH(CH ₃) - CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-56	(R) CH(CH ₃) - CCl ₃	H
A-57	(R) CH(CH ₃) - CCl ₃	CH ₃
A-58	(R) CH(CH ₃) - CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-59	(S) CH(CH ₃) - CCl ₃	H
A-60	(S) CH(CH ₃) - CCl ₃	CH ₃
A-61	(S) CH(CH ₃) - CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-62	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-63	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-64	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-65	Cyclopentyl	H
A-66	Cyclopentyl	CH ₃
A-67	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-68	- (CH ₂) ₄ CH (CH ₃) (CH ₂) ₄ -	

[0049] Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus den Klassen der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

[0050] Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen sowie an den Samen dieser Pflanzen.

[0051] Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

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

[0052] Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie Paecilomyces variotii im Materialschutz (z. B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

[0053] Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

[0054] Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

[0055] Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

[0056] Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

[0057] Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach

der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts.

[0058] Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

[0059] Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z. B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsformen richten sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie sollte in jedem Fall eine feine gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

[0060] Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z. B. Xylol), chlorierte Aromaten (z. B. Chlorbenzole), Paraffine (z. B. Mineralölfraktionen), Alkohole (z. B. Methanol, Butanol), Ketone (z. B. Cyclohexanon), Amine (z. B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z. B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z. B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z. B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

[0061] Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenylether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkohol-Ethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypolypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

[0062] Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen mit mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z. B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon und Wasser in Betracht.

[0063] Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

[0064] Granulate, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z. B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z. B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

[0065] Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

[0066] Beispiele für Formulierungen sind:

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselgel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselgels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 mol Ethylenoxid an 1 mol Ölsäure-N-monoethanoamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Rizinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 mol Ethylenoxid an 1 mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Rizinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfat-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselgel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).

VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).

VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 mol Ethylenoxid an 1 mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfat-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselgel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

[0067] Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z. B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

[0068] Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

[0069] Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsbereiten Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

[0070] Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

[0071] Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1 : 10 bis 10 : 1 zuge-mischt werden.

[0072] Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, z. B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

[0073] Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam an-

gewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, aber nicht einschränken:

Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylenbis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)disulfid;

Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sek.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sek.-Butyl-4,6-dinitrophenylisopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäurediisopropylester;

heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolinacetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethylphthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]-chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazolcarbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylaminobenzimidazol, 2-(Furyl-(2))benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthiotetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthiophthalimid, N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzothiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-thiol-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäureanilid, 2-Methylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethylfuran-3-carbonsäureanilid, N-Cyclohexyl-2,5-dimethylfuran-3-carbonsäureamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethylfuran-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäureanilid, 2-Iod-benzoesäureanilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholino bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecylmorpholino bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholino, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazolylharnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol, α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidinmethanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methylpyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyrimidinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)benzol, Strobilurine wie Azoxystrobin, Kresoxim-methyl, Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(2-phenoxyphenyl)]acetamid, Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(2,5-dimethylphenoxy)-o-tolyl]acetamid, Picoxystrobin, Pyraclostrobin, Trifloxystrobin, Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin, Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril, Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)acrylsäuremorpholid, sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-furoyl-(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)alaninmethylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-([N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoxyimino]acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethylphenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((Bis-(4-fluorphenyl)methylsilyl)methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Synthesebeispiele

[0074] Die in dem nachstehenden Synthesebeispiel wiedergegebene Vorschrift wurde unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt. Weitere 5-Chlor-Verbindungen der Formel II, die zur Gewinnung der weiteren Verbindungen I verwendet wurden, sind in der folgenden Tabelle II aufgeführt.

Beispiel 1: Darstellung von 5-Cyano-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)-7-isopropylamino-[1,2,4]-triazolo[1,5- α]-pyrimidin

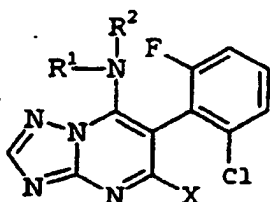
[0075] Eine Mischung von 0,1 mol 5-Chlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)-7-isopropylamino-[1,2,4]-triazolo-

lo[1,5- α]-pyrimidin [vgl. EP-A 550 113] und 0,25 mol Tetraethylammoniumcyanid in 750 ml Dimethylformamid wurde etwa 16 Stunden lang bei 20–25°C gerührt. Diese Mischung wurde mit Wasser und Methyl-tert.-butylether versetzt, und die organische Phase wurde abgetrennt, mit Wasser gewaschen, getrocknet und filtriert. Destillatives Entfernen des Lösungsmittels vom Filtrat und Chromatographie an Kieselgel lieferten 7,1 g der Titelverbindung mit Schmp. 159°C.

Beispiel 2: Darstellung von 5-Methoxy-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)-7-isopropylamino-[1,2,4]-triazolo[1,5- α]-pyrimidin

[0076] Eine Lösung von 65 mmol 5-Chlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5- α]pyrimidin (vgl. EP-A 550 113) in trockenem Methanol wurde bei 20–25°C mit 71,5 mmol einer 30%igen Lösung von Natriummethanolat versetzt. Nachdem diese Lösung bei dieser Temperatur etwa 16 Stunden lang gerührt worden war, wurde das Methanol abgedampft und der Rückstand in Dichlormethan gelöst. Die organische Phase wurde abgetrennt, mit Wasser gewaschen, getrocknet und filtriert. Destillatives Entfernen des Lösungsmittels vom Filtrat und Chromatographie an Kieselgel lieferten 4,2 g der Titelverbindung mit Schmp. 182°C.

Tabelle I



I

Nr.	R ¹	R ²	X	phys. Daten (Schmp. [°C]) IR [cm ⁻¹]
I-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	CN	139
I-2	CH(CH ₃) ₂	H	CN	159
I-3	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CN	196
I-4	Cyclopentyl	H	CN	
I-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CN	212
I-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CN	

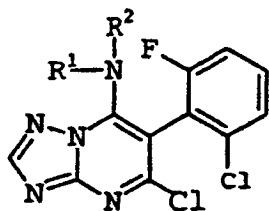
Nr.	R ¹	R ²	X	phys. Dater (Schmp. [°C]) IR [cm ⁻¹]
I-7	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	
I-8	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	CN	
I-9	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	CN	
I-10	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	CN	
I-11	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CN	
I-12	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CN	
I-13	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CN	
I-14	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	CN	
I-15	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	CN	
I-16	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	CN	
I-17	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CN	
I-18	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CN	
I-19	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CN	
I-20	CH ₂ CF ₃	H	CN	
I-21	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	
I-22	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	
I-23	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	182
I-24	Cyclopentyl	H	OCH ₃	
I-25	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	
I-26	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	
I-27	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	
I-28	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	
I-29	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	
I-30	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	
I-31	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	
I-32	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	
I-33	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	
I-34	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	
I-35	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	
I-36	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	
I-37	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₃	
I-38	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₃	
I-39	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₃	
I-40	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	
I-41	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	
I-42	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	
I-43	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₂ CH ₃	135
I-44	cyclopentyl	H	OCH ₂ CH ₃	

Nr.	R ¹	R ²	X	phys. Daten (Schmp. [°C]) IR [cm ⁻¹]
I-45	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	
I-46	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	
I-47	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	
I-48	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-49	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-50	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-51	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	
I-52	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	
I-53	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH ₃	
I-54	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-55	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-56	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-57	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-58	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-60	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CH ₃	
I-61	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	
I-62	CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-63	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH(CH ₃) ₂	156
I-64	Cyclopentyl	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-65	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	102
I-66	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	
I-67	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	
I-68	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-69	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-70	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-71	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-72	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-73	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-74	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-75	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-76	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-77	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-78	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-79	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-80	CH ₂ CF ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	
I-81	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-82	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂	

Nr.	R ¹	R ²	X	phys. Daten (Schmp. [°C]) IR [cm ⁻¹]
				IR [cm ⁻¹]
5	I-83	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		2990, 1655, 985
	I-84	Cyclopentyl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-85	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-86	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
0	I-87	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-88	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-89	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-90	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-91	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
5	I-92	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-93	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-94	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-95	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
0	I-96	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-97	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-98	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-99	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
5	I-100	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CH=CH ₂
	I-101	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂
	I-102	CH(CH ₃) ₂	H	OCHF ₂
	I-103	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCHF ₂ 138
	I-104	Cyclopentyl	H	OCHF ₂
	I-105	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂
	I-106	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCHF ₂
	I-107	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂
	I-108	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCHF ₂
	I-109	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCHF ₂
	I-110	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	OCHF ₂
	I-111	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCHF ₂
	I-112	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCHF ₂
	I-113	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	OCHF ₂
	I-114	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCHF ₂
	I-115	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCHF ₂
	I-116	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	OCHF ₂
	I-117	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCHF ₂
	I-118	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCHF ₂

Nr.	R ¹	R ²	X	phys. Daten (Schmp. [°C]) IR [cm ⁻¹]
I-119	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	OCHF ₂	
I-120	CH ₂ CF ₃	H	OCHF ₂	

Tabelle II



II

Nr.	R ¹	R ²	phys. Daten (Schmp. [°C])
II-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	136
II-2	CH(CH ₃) ₂	H	143
II-3	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		150
II-4	cyclopentyl	H	62
II-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	167
II-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	148
II-7	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	151
II-8	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	150
II-9	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	147
II-10	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	147
II-11	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	145
II-12	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	145
II-13	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	145
II-14	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	188
II-15	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	191
II-16	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₃	H	191
II-17	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	179
II-18	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	172
II-19	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	172
II-20	CH ₂ CF ₃	H	211
II-21	H	H	250

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

[0077] Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I wurde durch die folgenden Versuche gezeigt:

[0078] Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol® EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1: Wirkung auf Alternaria solani in Tomaten

[0079] Blätter von in Töpfen herangezogenen Tomatensetzlingen der Sorte „Große Fleischtomate St. Pierre“ wurden mit wäßrigen Brühen besprüht, die aus einer aus 10% Wirkstoff, 63% Cyclohexanon und 27% Emulgator bestehenden Stammlösung hergestellt worden waren. Nach 24 Stunden wurden die Blätter mit einer Zoosporensuspension von Alternaria solani (1,7 × 10⁶ Sporen pro ml einer 2%igen Biomalzlösung) infiziert. Die Pflanzen wurden dann in eine mit Wasserdampf gesättigte Kammer gestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten Pflanzen so stark ausgebreitet, daß die fungizide Wirksamkeit der Substanzen abgeschätzt werden konnte.

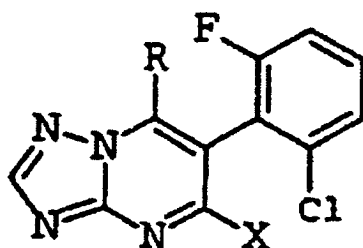
[0080] In diesem Test zeigten die Pflanzen, die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, I-3 und I-23 behandelt wor-

den waren, eine Infektion von bis zu 3%, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 infiziert waren.

Anwendungsbeispiel 2: Wirkung auf *Plasmopara viticola*

[0081] Blätter von in Töpfen herangezogenen Reben der Sorte „Müller Thurgau“ wurden mit wässrigen Brühen besprüht, die aus einer aus 10% Wirkstoff, 63% Cyclohexanon und 27% Emulgator bestehenden Stammlösung hergestellt worden waren. Zur Beurteilung der Wirkungsdauer wurden die Pflanzen, nachdem die aufgesprühte Schicht getrocknet war, 8 Tage lang ins Gewächshaus gegeben. Die Blätter wurden dann mit einer Zoosporensuspension des Pilzes *Plasmopara viticola* infiziert und zunächst bei 24°C in eine mit Dampf gesättigte Kammer gestellt und dann 5 Tage lang in einem Gewächshaus bei 20 bis 30°C gehalten. Zur Beschleunigung und Intensivierung des Sporangienträgerausbruchs wurden die Pflanzen dann abermals für 16 Stunden in der feuchten Kammer aufgestellt. Dann erfolgte die Beurteilung des Ausmaßes des Pilzbefalls an der Unterseite der Blätter. In diesem Test zeigten die Pflanzen, die mit 250 ppm der Verbindungen I-1 und I-2 behandelt worden waren, eine Infektion von bis zu 20%, während die unbehandelten Pflanzen zu 85% infiziert waren.

[0082] Als Vergleichsverbindungen für die folgenden Vergleichstests wurden die Wirkstoffe A bis E verwendet, die aus EP-A 550 113, WO-A 99/41255 bzw. US 5,994,360 bekannt sind:



Nr.	bekannt aus	R	X
A	EP-A 550 113, Nr. 106	Isopropylamino	Chlor
B	EP-A 550 113, Nr. 111	Diethylamino	Chlor
C	WO-A 99/41255, Nr. 38	Cyclohexyl	Methoxy
D	WO-A 99/41255, Nr. 39	Cyclohexyl	Cyano
C	US 5,994,360, Bsp. 1B	4-CH ₃ -Piperidin	Methyl

Vergleichstest 1: Fungizide Bekämpfung von Fruchtfäule an Tomaten (*Alternaria solani*)

[0083] Junge Setzlinge von Tomatenpflanzen der Sorte „Große Fleischtomate St. Pierre“ wurden in Töpfen bis zum 2- bis 4-Blatt-Stadium herangezogen. Diese Pflanzen wurden mit einer wässrigen Suspension, die die in der Tabelle unten angegebene Konzentration an Wirkstoff enthielt und aus einer Stammlösung, die 10% Wirkstoff, 85% Cyclohexanon und 5% Emulgator enthielt, hergestellt worden war, tropfnaß besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer wässrigen Suspension von *Alternaria solani*, die $0,2 \times 10^6$ Sporen pro ml enthielt, inokuliert. Die Versuchspflanzen wurden dann sofort in eine feuchte Kammer überführt. Nach 6 Tagen bei 20 bis 23°C und einer relativen Feuchtigkeit von nahezu 100 wurde das Ausmaß des Pilzbefalls an den Blättern visuell als % erkrankte Blattfläche beurteilt.

[0084] Bei diesem Versuch zeigten Pflanzen, die mit 250 ppm der Verbindung I-3 bzw. I-23 behandelt worden waren, eine Infektion von nicht mehr als 7%, während Pflanzen, die mit 250 ppm der Vergleichsverbindungen C bzw. D behandelt worden waren, zu wenigstens 60% infiziert waren, und die unbehandelten Pflanzen zu 100 infiziert waren.

[0085] In einem anderen Versuch zeigten die Pflanzen, die mit 16 ppm Verbindung I-3 behandelt worden waren, eine Infektion von 15%, während die Pflanzen, die mit 16 ppm Vergleichsverbindung E behandelt worden waren, zu 30% infiziert waren, und die unbehandelten Pflanzen zu 90% infiziert waren.

Vergleichstest 2: Bekämpfung der durch *Pyrenophora teres* verursachten Netzfleckenkrankheit auf Gerste

[0086] Die ersten voll entwickelten Blätter von in Töpfen herangezogener Gerste der Sorte „Igri“ wurden mit einer wässrigen Suspension, die die in der Tabelle unten angegebene Konzentration an Wirkstoff oder einer Mischung davon enthielt und aus einer 10% Wirkstoff, 85% Cyclohexanon und 5% Emulgator enthaltenden Stammlösung hergestellt worden war, tropfnaß besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora teres tritici*, die $0,02 \times 10^6$ Sporen/ml enthielt, inokuliert. Die Versuchspflanzen wurden dann sofort in eine feuchte Kammer im Gewächshaus überführt. Nach 6-tägiger Kultivierung bei 20 bis 24°C und einer relativen Feuchtigkeit von nahezu 100 wurde das Ausmaß des Pilzbefalls an den Blättern visuell als % erkrankte Blattfläche beurteilt.

[0087] In diesem Versuch zeigten Pflanzen, die mit 250 ppm der Verbindung I-3 bzw. I-23 behandelt worden waren, eine Infektion von nicht mehr als 7%, während Pflanzen, die mit 250 ppm der Vergleichsverbindungen C bzw. D behandelt worden waren, und die unbehandelten Pflanzen zu 100 infiziert waren.

Vergleichstest 3: Fungizide Bekämpfung von durch *Septoria tritici* verursachte Blattdürre an Weizen (protektiv)

[0088] Blätter von in Töpfen herangezogenen Weizensetzlingen der Sorte „Riband“ wurden mit einer wässrigen Suspension, die die unten beschriebene Konzentration an Wirkstoff enthielt und aus einer Stammlösung, die 10% Wirkstoff, 85% Cyclohexanon und 5% Emulgator enthielt, hergestellt worden war, tropfnaß besprüht. Die Pflanzen wurden an der Luft trocknen gelassen. Am nächsten Tag wurden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Septoria tritici*, die $2,0 \times 10^6$ Sporen/ml enthielt, inokuliert. Die Versuchspflanzen wurden dann sofort in eine feuchte Kammer überführt. Nach 2 Wochen bei 18–22°C und einer relativen Feuchtigkeit von nahezu 100 wurde das Ausmaß des Pilzbefalls an den Blättern visuell als % erkrankte Blattfläche beurteilt.

[0089] In diesem Versuch zeigten Pflanzen, die mit 63 ppm der Verbindungen I-3, I-5 bzw. I-23 behandelt worden waren, keine Infektion, während die Pflanzen, die mit 63 ppm der Vergleichsverbindungen B, C bzw. D behandelt worden waren, zu 20 bis 60% infiziert waren und die unbehandelten Pflanzen zu 90% infiziert waren.

Vergleichstest 4: Fungizide Bekämpfung von durch *Pyricularia oryzae* verursachten Reisbrand (protektiv)

[0090] Blätter von in Töpfen herangezogenen Reissetzlingen der Sorte „Tai-Nong 67“ wurden mit einer wässrigen Suspension, die die unten beschriebene Konzentration an Wirkstoff enthielt und aus einer 10% Wirkstoff, 85% Cyclohexanon und 5% Emulgator enthaltenden Stammlösung hergestellt worden war, tropfnaß besprüht. Die Pflanzen wurden an der Luft trocknen gelassen. Am nächsten Tag wurden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae*, die $1,0 \times 10^6$ Sporen/ml enthielt, inokuliert. Die Versuchspflanzen wurden dann sofort in eine feuchte Kammer überführt. Nach 6 Tagen bei 22–24°C und einer relativen Feuchtigkeit von nahezu 100 wurde das Ausmaß des Pilzbefalls an den Blättern visuell als % erkrankte Blattfläche beurteilt.

[0091] In diesem Versuch zeigten Pflanzen, die mit 250 ppm der Verbindungen I-3, I-5, I-23 bzw. I-63 behandelt worden waren, eine Infektion von bis zu 30%, während Pflanzen, die mit 250 ppm der Vergleichsverbindungen A, B bzw. E behandelt worden waren, 60 bis 80% infiziert waren und die unbehandelten Pflanzen zu 90 bis 100 infiziert waren.

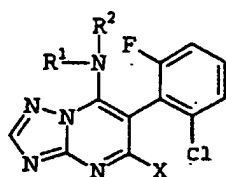
Vergleichstest 5: Protektive Bekämpfung von Echtem Mehltau auf Gurke

[0092] Gurkensetzlinge der Sorte „Chinesische Schlange“ wurden bis zum 2-Blatt-Stadium in Töpfen herangezogen. Die Pflanzen wurden mit einer wässrigen Suspension, die die unten beschriebene Konzentration an Wirkstoff enthielt und aus einer 10% Wirkstoff, 85% Cyclohexanon und 5% Emulgator enthaltenden Stammlösung hergestellt worden war, tropfnaß besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von Echtem Gurkenmehltau (*Sphaerotheca fuliginea*) inokuliert. Die Versuchspflanzen wurden dann in einem Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und einer relativen Feuchtigkeit zwischen 60 und 80% kultiviert. Nach 8 Tagen wurde das Ausmaß des Pilzbefalls an den Blättern visuell als % erkrankte Blattfläche beurteilt.

[0093] In diesem Versuch zeigten Pflanzen, die mit 16 ppm Verbindung I-23 behandelt worden waren, keine Infektion, während Pflanzen, die mit 16 ppm der Vergleichsverbindung E behandelt worden waren, zu 90% infiziert waren und die unbehandelten Pflanzen zu 100% infiziert waren.

Patentansprüche

1. 6-(2-Chlor-6-fluorphenyl)triazolopyrimidine der Formel I



I

in der

R¹ und R² unabhängig Wasserstoff oder

C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkadienyl oder C₁-C₁₀-Halogenalkyl,

C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₁₀-Bicycloalkyl, Phenyl, Naphthyl oder

5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, das ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält, oder

5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, das ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält,

bedeuten, oder

wo die R¹- und R²-Reste unsubstituiert oder teilweise oder ganz halogeniert sein können oder eine bis drei Gruppen R³,

wobei R³ Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy,

C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy,

C₂-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Alkinyloxy und C₁-C₄-Alkylendioxy, das halogeniert sein kann, bedeutet,

tragen können, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem dazwischenliegenden Stickstoffatom einen 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Ring, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält und der durch ein bis drei R³-Reste substituiert sein kann, bedeuten;

X Cyano, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₈-Alkenyloxy bedeutet.

2. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, wobei

R¹ geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, geradkettiges oder verzweigtes C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₉-Bicycloalkyl bedeutet, und

R² Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl bedeutet, oder

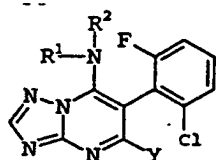
R¹ und R² gemeinsam mit dem dazwischenliegenden Stickstoffatom einen heterocyclischen Ring mit 5 oder 6 Kohlenstoffatomen, der gegebenenfalls durch ein oder zwei C₁-C₆-Alkylgruppen substituiert ist, bedeuten.

3. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2, wobei R² für Wasserstoff steht.

4. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 3, wobei X für Methoxy steht.

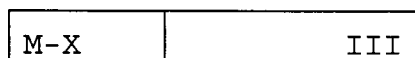
5. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 3, wobei X für Cyano steht.

6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 5, bei dem man 5-Halogen-6-phenyltriazolopyrimidine der Formel II



II

in der Y für Halogen steht, mit einer Verbindung der Formel III



in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkaliation steht und X wie in Formel I definiert ist, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I umsetzt.

7. Verwendung von Verbindungen der Formel II nach Anspruch 6 als Zwischenprodukt.

8. Zusammensetzung, die sich für die Bekämpfung phytopathogener Pilze eignet, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I nach Anspruch 1.

9. Verfahren zur Bekämpfung phytopathogener Pilze, bei dem man die Pilze oder die Materialien, Pflanzen, den Boden oder das Saatgut, die, der bzw. das gegen Pilzbefall zu schützen ist, mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I nach Anspruch 1 behandelt.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen