

(11) Número de Publicação: **PT 1414302 E**

(51) Classificação Internacional:
A01N 43/90 (2006.01) **C07D 487/04** (2006.01)

(12) FASCÍCULO DE PATENTE DE INVENÇÃO

(22) Data de pedido: 2002.07.16	(73) Titular(es): BASF AKTIENGESELLSCHAFT 67056 LUDWIGSHAFEN DE
(30) Prioridade(s): 2001.07.26 DE 10136118	
(43) Data de publicação do pedido: 2004.05.06	(72) Inventor(es): JOACHIM RHEINHEIMER ANDREAS GYPSE MARKUS GEWEHR EBERHARD AMMERMAN SIEGFRIED STRATHMAN DE DE DE DE DE
(45) Data e BPI da concessão: 2007.03.21 005/2007	(74) Mandatário: MARIA SILVINA VIEIRA PEREIRA FERREIRA RUA CASTILHO, N.º 50, 5º - ANDAR 1269-163 LISBOA PT

(54) Epígrafe: **7-AMINOTRIAZOLOPIRIMIDINAS PARA COMBATER FUNGOS NOCIVOS**

(57) Resumo:

RESUMO

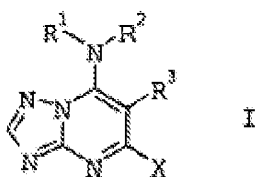
"7-AMINOTRIAZOLOPIRIMIDINAS PARA COMBATER FUNGOS NOCIVOS"

As 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula (I), em que os substituintes têm os seguintes significados: R^1 , R^2 = hidrogénio, alquilo, alcenilo, alcinilo, cicloalquilo, fenilo, naftilo; ou heterociclilo de 5 ou 6 elementos, contendo um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio e um átomo de enxofre ou de oxigénio; ou heteroarilo de 5 ou 6 elementos contendo um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio e um átomo de enxofre ou de oxigénio, ou R^1 e R^2 podem formar juntamente com o átomo de nitrogénio que os liga, um anel de 5 ou 6 elementos, que contém um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio e um átomo de enxofre ou de oxigénio; R^3 = alquilo, alcenilo, alcinilo, cicloalquilo, fenilalquilo e haloalquilo; podendo R^2 e R^3 ser não substituídos ou substituídos parcial ou totalmente de acordo com a descrição; X = halogéneo, ciano, alcoxi, haloalquilo, fenilo ou fenilo substituído por R^a ; processos e produtos intermediários para o seu fabrico, os meios que as contêm e a respectiva utilização.

DESCRIÇÃO

"7-AMINOTRIAZOLOPIRIMIDINAS PARA COMBATER FUNGOS NOCIVOS"

A presente invenção é relativa a 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I



em que os substituintes têm os seguintes significados:

R^1, R^2 hidrogénio, alquilo C_1-C_{10} , alcenilo C_2-C_{10} ,
 alcinilo C_2-C_{10} , C_3-C_8 -cicloalquilo, fenilo,
 naftilo; ou

heterociclilo de 5 ou 6 elementos, contendo um a
 quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos
 de nitrogénio e um átomo de enxofre ou um átomo
 de oxigénio; ou

heteroarilo de 5 ou 6 elementos, contendo um a
 quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos
 de nitrogénio e um átomo de enxofre ou um átomo
 de oxigénio,

podendo R^1 e R^2 , se diferentes de hidrogénio e
 independentemente um do outro, ser parcial ou
 totalmente halogenados, e/ou ter um a três
 radicais do grupo R^a

R^a ciano, nitro, hidroxí, alquilo C_1-C_6 , C_1-C_6 -

haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, alcoxi C₁-C₆, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilamina, di-C₁-C₆-alquilamina, alcenilo C₂-C₆, C₂-C₆-alceniloxi, alcinilo C₂-C₆, C₃-C₆-alciniloxi e oxi-C₁-C₄-alcilenoxi eventualmente halogenado; ou

R¹ e R² podem formar juntamente com o átomo de nitrogénio que os liga, um anel de 5 ou 6 elementos, que contém um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio e um átomo de enxofre ou um átomo de oxigénio, e que pode ser substituído por um a três radicais do grupo R^a;

R³ alquilo C₁-C₁₀, alcenilo C₂-C₁₀, alcinilo C₂-C₁₀, C₃-C₈-cicloalquilo, fenil-C₁-C₁₀-alquilo,

podendo R³ ser não substituído ou ser parcial ou totalmente halogenado e/ou ter um a três radicais do grupo R^a, ou

C₁-C₁₀-haloalquilo, que pode ter um a três radicais do grupo R^a;

X halogéneo, ciano, alcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-haloalquilo, fenilo ou fenilo substituído por R^a;

e os respectivos sais.

Além disso, a invenção é relativa a processos para o fabrico dos compostos I, e a meios e à utilização dos compostos I no combate a fungos nocivos.

As 6-aril-triazolopirimidinas são reveladas no WO 98/46608 e no EP A 550 113. As 6-benzil-triazolopirimidinas substituídas em especial por grupos aromáticos, com acção farmacêutica, são conhecidas a partir dos US 5 231 094 e US 5 387 747. O EP A 141 317 revela 7-aminotriazolopirimidinas, que podem ter um radical alquilo na 5.^a posição. As 6-cicloalquiltriazolopirimidinas com diversos radicais na 5.^a posição são mencionadas no EP A 613 900. As 5,7-di-halogeno-triazolopirimidinas são propostas no US 5 612 345 e no WO 94/20501.

Os compostos descritos nos WO 98/46608, EP A 550 113, EP A 141 317, EP A 613 900, US 5 612 345 e WO 94/20501 adequam-se como fitofármacos contra fungos nocivos.

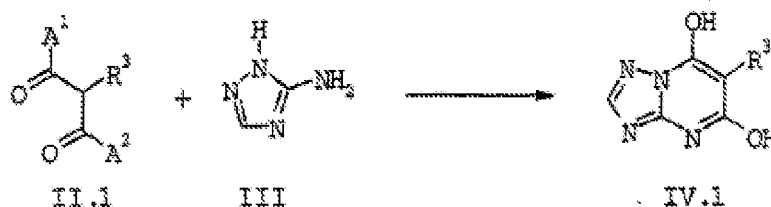
No entanto, a sua acção não é em muitos casos satisfatória. Por isso, teve-se como objectivo arranjar compostos com uma melhor eficácia.

Em conformidade com isso, descobriu-se as 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I. Além disso, descobriu-se produtos intermediários e processos para o fabrico dos compostos I, e a utilização dos compostos I e dos meios que os contêm no combate a fungos nocivos.

Os compostos com a fórmula I distinguem-se dos compostos conhecidos dos documentos acima mencionados pela combinação dos substituintes X com o radical R³ na estrutura da triazolopirimidina.

Os compostos com a fórmula I, em que X significa halogéneo, são obtidos, por exemplo, a partir de compostos dicarbonilo com a fórmula II.1, que são ciclizados com 3-amino-1,2,4-

triazol com a fórmula III em hidroxitriazolopirimidinas com a fórmula IV.1:



Esta transformação ocorre usualmente a temperaturas de 25°C a 210°C, de preferência de 120°C a 180°C, na presença de uma base [ver EP A 770615].

As bases tratam-se geralmente de bases orgânicas, por exemplo, de aminas terciárias como trimetilamina, trietilamina, triisopropiletilamina, tributilamina e N-metilpiperidina e piridina. É dada especial preferência a trietilamina e tributilamina.

As bases são dum modo geral empregues em quantidades catalíticas, podendo também ser empregues de forma equimolar, em excesso ou eventualmente como solvente.

Geralmente, os eductos são transformados uns com os outros em quantidades equimolares. Poderá ser favorável para o rendimento, empregar II.1 em excesso em relação a III.

As substâncias de partida necessárias ao fabrico dos compostos I são conhecidas na literatura ou podem ser produzidas de acordo com a literatura citada ["Heterocycl." 1996, pág. 1031 - 1047; "Tetrahedron Lett." 1966, 24, 2661 - 2668] ou podem ser obtidas no mercado.

Em seguida, transforma-se as hidroxitriazolopirimidinas com

a fórmula IV.1 com um meio de halogenação, nas halogenotriazolopirimidinas com a fórmula V.1:



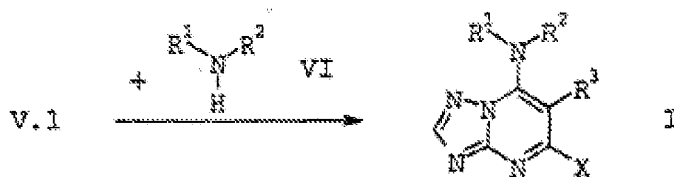
Usualmente, esta transformação é realizada a temperaturas de 0°C a 150°C, de preferência de 80°C a 125°C, num solvente orgânico inerte ou sem solvente adicional [ver o EP A 770 615].

Os meios de halogenação apropriados são de preferência os meios de bromação ou de cloração, como, por exemplo, brometo de fosforoxi ou cloreto de fosforoxi, em substância ou na presença dum solvente.

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos como pentano, hexano, ciclo-hexano e petroléter, hidrocarbonetos aromáticos como tolueno, o-xileno, m-xileno e p-xileno, com especial preferência tolueno, o-xileno, m-xileno e p-xileno.

Também é possível empregar misturas dos solventes mencionados.

Em seguida, transforma-se as halogenotriazolopiridiminas com a fórmula V.1 com uma amina com a fórmula VI, nas 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I, em que X significa halogéneo:



Usualmente, esta transformação é realizada a temperaturas de 0°C a 70°C, de preferência de 10°C a 35°C, num solvente orgânico inerte na presença de uma base [ver o EP A 550 113].

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos aromáticos, tais como tolueno, o-xileno, m-xileno e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc.-butilmetílico, dioxano, anisol e tetra-hidrofurano.

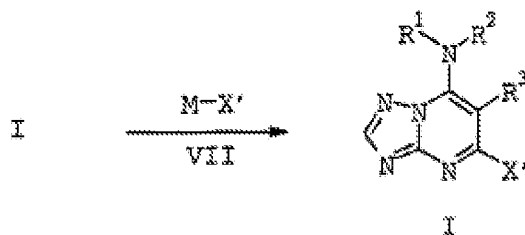
Como bases tem-se geralmente em consideração compostos inorgânicos como os hidróxidos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tais como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio; os óxidos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio; os hidretos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tais como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio; as amidas de metais alcalinos, tais como amida de lítio, amida de sódio e amida de potássio; os carbonatos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio; assim como os hidrogenocarbonatos de metais alcalinos, tais como hidrogenocarbonato de sódio; e compostos organometálicos, em particular alquilos de metais alcalinos, tais como metil-lítio, butil-lítio e fenil-

lítio; halóides de alquil-magnésio, tais como cloreto de metil-magnésio; e alcoólatos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tais como metanolato de sódio, etanolato de sódio, etanolato de potássio, terc.-butanolato de potássio e dimetoximagnésio; e, para além disso, bases orgânicas como, por exemplo, aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tri-isopropiletilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, assim como aminas bicíclicas. É dada especial preferência a trietilamina, carbonato de potássio e carbonato de sódio.

De forma geral, empregam-se as bases em quantidades catalíticas, mas também podem ser empregues de forma equimolar, em excesso ou eventualmente como solvente. Em alternativa, pode recorrer-se a um excesso do composto VI como base.

Os eductos são transformados geralmente uns com os outros em quantidades equimolares. Em termos de rendimento, poderá constituir uma vantagem empregar VI em excesso em relação a V.I.

De modo a obter as 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I, em que X significa ciano ou alcoxi C₁-C₄, transforma-se as 7-aminotriazolpirimidinas com a fórmula I com um composto com a fórmula VII:



Neste caso, M significa um catião de amónio, catião de tetraalquilamónio, de metal alcalino ou de metal alcalino-terroso e X' significa ciano ou alcoxi.

Esta transformação ocorre usualmente a temperaturas de 0°C a 150°C, de preferência de 20°C a 75°C, num solvente orgânico inerte [ver WO 99/41255].

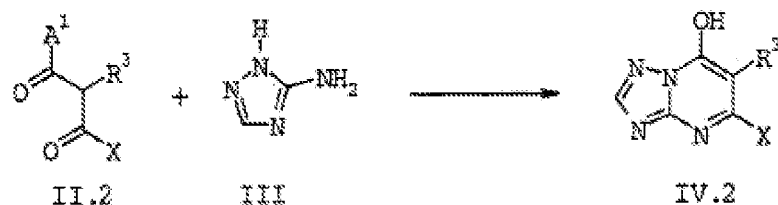
Os solvente apropriados são éteres como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc.-butilmetílico, dioxano, anisol e tetra-hidrofurano, álcoois como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc.-butanol, e sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida e dimetilacetamida, com especial preferência éter dietílico, tetra-hidrofurano, metanol e dimetilformamida.

Também é possível empregar misturas dos solventes mencionados.

Os eductos são geralmente transformados em quantidades equimolares uns com os outros. Poderá ser vantajoso para o rendimento empregar VII em excesso em relação a I.

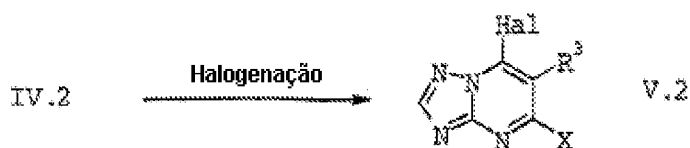
As 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I, em que X significa C₁-C₄-haloalquilo ou fenilo eventualmente substituído por R^a, podem ser obtidas a partir de compostos dicarbonilo com a fórmula II.2, que são ciclizados com 3-

amino-1,2,4-triazol com a fórmula III, nas 7-hidroxitriazolpirimidinas com a fórmula IV.2:



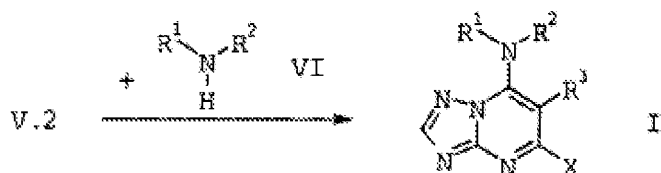
Esta transformação ocorre sob as mesmas condições da transformação anteriormente descrita de II.1 em IV.1.

Em seguida, transforma-se as 7-hidroxitriazolpirimidinas com a fórmula IV.2 com um meio de halogenação nas 7-halogenotriazolpirimidinas com a fórmula V.2:



Esta transformação ocorre sob as mesmas condições da transformação anteriormente descrita de IV.1 em V.1.

Depois, transforma-se o composto V.2 com uma amina com a fórmula VI nos compostos com a fórmula I:



Esta transformação ocorre sob as mesmas condições da transformação anteriormente descrita de V.1 em I.

As misturas de reacção são acabadas de forma usual, através, por exemplo de mistura com água, separação das fases e, eventualmente, purificação cromatográfica dos produtos brutos. Os produtos intermediários e os produtos finais precipitam-se em parte na forma de óleos incolores ou viscosos ligeiramente acastanhados, que são libertados de teores voláteis ou purificados a baixa pressão e a uma temperatura moderadamente elevada. Se os produtos intermediários e os produtos finais forem obtidos na forma de sólidos, a purificação também pode ter lugar por recristalização ou por digestão.

Se os compostos individuais I não poderem ser obtidos pelas vias anteriormente descritas, os mesmos poderão ser produzidos por derivação de outros compostos I.

Nas definições dos símbolos indicadas nas fórmulas anteriores, empregou-se conceitos genéricos dum modo geral representativos dos seguintes substituintes:

Halogéneo: flúor, cloro, bromo e iodo;

Alquilo: radicais hidrocarboneto saturados, de cadeia linear ou ramificados, com 1 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono, como, por exemplo, alquilo C_1-C_6 como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-

etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo e 1-etil-2-metilpropilo;

Haloalquilo: grupos alquilo de cadeia linear ou ramificados, com 1 a 10 átomos de carbono (como anteriormente referido), em que, nestes grupos, os átomos de hidrogénio podem ser parcial - por exemplo, uma a três vezes - ou totalmente substituídos por átomos de halogéneo como anteriormente referido, como, por exemplo, C₁-C₂-halogenoalquilo como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo e pentafluoroetilo;

Alcoxi: grupos alquilo de cadeia linear ou ramificados, com 1 a 6 átomos de carbono (como anteriormente referido), ligados por um átomo de oxigénio (-O-) à estrutura;

Haloalcoxi: grupos de halogenoalquilo de cadeia linear ou ramificados, com 1 a 6 átomos de carbono (como anteriormente referido), ligados por um átomo de oxigénio (-O-) à estrutura;

Alquiltio: grupos alquilo de cadeia linear ou ramificados, com 1 a 6 átomos de carbono (como anteriormente referido), ligados por um átomo de enxofre (-S-) à estrutura;

Alquilamina: um grupo alquilo de cadeia linear ou ramificado, com 1 a 6 átomos de carbono (como anteriormente referido), ligado por um grupo amina (-NH-) à estrutura;

Dialquilamina: dois grupos alquilo de cadeia linear ou ramificados, independentes um do outro, com 1 a 6 átomos de carbono respectivamente (como acima referido), ligados por um átomo de nitrogénio à estrutura;

Alcenilo: radicais hidrocarboneto insaturados, de cadeia linear ou ramificados, com 2 a 6 ou 10 átomos de carbono e uma ligação dupla numa posição opcional, como, por exemplo, alcenilo C_2-C_6 como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo,

2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo e 1-etil-2-metil-2-propenilo;

Alceniloxi: radicais hidrocarboneto insaturados, de cadeia linear ou ramificados, com 3 a 6 átomos de carbono e uma ligação dupla numa posição opcional, desde que não vizinha do heteroátomo (como anteriormente referido), ligados por um átomo de oxigénio (-O-) à estrutura;

Alcinilo: grupos hidrocarboneto de cadeia linear ou ramificados, com 2 a 6 ou 10 átomos de carbono e uma ligação tripla numa posição opcional, como, por exemplo, alcinilo C_2-C_6 como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo e 1-etil-1-metil-2-propinilo;

Alciniloxi: radicais hidrocarboneto insaturados, de cadeia linear ou ramificados, com 3 a 6 átomos de carbono e uma

ligação tripla numa posição opcional, desde que não vizinha do heteroátomo (como anteriormente referido), ligados por um átomo de oxigénio (-O-) à estrutura;

Cicloalquilo: grupos hidrocarboneto monocíclicos saturados, com 3 a 5, 6 ou 8 elementos do anel carbono, como, por exemplo, cicloalquilo C_3-C_8 como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclo-hexilo, ciclo-heptilo e ciclooctilo;

Heterociclos de 5 ou 6 elementos (heterociclilo), contendo, a par de elementos de anel de carbono, um a quatro átomos de nitrogénio e/ou um átomo de oxigénio ou de enxofre, ou um átomo de oxigénio e/ou de enxofre, tais como, por exemplo, 2-tetra-hidrofuranilo, 3-tetra-hidrofuranilo, 2-tetra-hidrotienilo, 3-tetra-hidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-il, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-diidrofur-2-ilo, 2,3-diidrofur-3-ilo, 2,4-diidrofur-2-ilo, 2,4-diidrofur-3-ilo, 2,3-diidrotien-2-ilo, 2,3-diidrotien-3-ilo, 2,4-diidrotien-2-ilo, 2,4-diidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-

ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-diidropirazol-1-ilo, 2,3-diidropirazol-2-ilo, 2,3-diidropirazol-3-ilo, 2,3-diidropirazol-4-ilo, 2,3-diidropirazol-5-ilo, 3,4-diidropirazol-1-ilo, 3,4-diidropirazol-3-ilo, 3,4-diidropirazol-4-ilo, 3,4-diidropirazol-5-ilo, 4,5-diidropirazol-1-ilo, 4,5-diidropirazol-3-ilo, 4,5-diidropirazol-4-ilo, 4,5-diidropirazol-5-ilo, 2,3-diidrooxazol-2-ilo, 2,3-diidrooxazol-3-ilo, 2,3-diidrooxazol-4-ilo, 2,3-diidrooxazol-5-ilo, 3,4-diidrooxazol-2-ilo, 3,4-diidrooxazol-3-ilo, 3,4-diidrooxazol-4-ilo, 3,4-diidrooxazol-5-ilo, 3,4-diidrooxazol-2-ilo, 3,4-diidrooxazol-3-ilo, 3,4-diidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiraniilo, 4-tetra-hidropiraniilo, 2-tetra-hidrotienilo, 3-hexa-hidropiridazinilo, 4-hexa-hidropiridazinilo, 2-hexa-hidropirimidinilo, 4-hexa-hidropirimidinilo, 5-hexa-hidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexa-hidrotriazin-2-ilo e 1,2,4-tetra-hidrotriazin-3-ilo;

Heteroarilo de 5 elementos, contendo um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio, e um átomo de enxofre ou de oxigénio: grupos heteroarilo de anel de 5, que podem conter, além de átomos de carbono, um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio e um átomo de enxofre ou de oxigénio como elementos do anel, como, por exemplo, 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-

tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo e 1,3,4-triazol-2-ilo;

Heteroarilo de 6 elementos, contendo um a três ou um a quatro átomos de nitrogénio: grupos heteroarilo de anel de 6, que podem conter, além de átomos de carbono, um a três ou um a quatro átomos de nitrogénio como elementos do anel, como, por exemplo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo e 1,2,4-triazin-3-ilo;

Oxialcilenoxi: cadeias não ramificadas bivalentes de 1 a 3 grupos CH_2 , estando as duas valências ligadas através dum átomo de oxigénio à estrutura, como, por exemplo, OCH_2O , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ e $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$.

Os compostos com a fórmula I também se podem encontrar na forma dos respectivos sais de aplicação na agricultura, não estando normalmente em questão o tipo do sal. Em geral, são considerados os sais daqueles catiões ou os sais de adição ácida daqueles ácidos cujos catiões ou aniões não afectem negativamente a acção fungicida dos compostos I.

Os catiões tratam-se em particular de iões de metais alcalinos, de preferência lítio, sódio e potássio, dos metais alcalino-terrosos, de preferência de cálcio e de magnésio, e dos metais de transição, de preferência manganês, cobre, zinco e ferro, e amónio, podendo, neste caso e se desejável, um a quatro átomos de hidrogénio

estarem substituídos por alquilo C_1-C_4 , hidroxi- C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -alcoxi- C_1-C_4 -alquilo, hidroxi- C_1-C_4 -alcoxi- C_1-C_4 -alquilo, fenilo ou benzilo, de preferência amónio, dimetilamónio, diisopropilamónio, tetrametilamónio, tetrabutylamónio, 2-(2-hidroxi-et-1-oxi)-et-1-ilamónio, di-(2-hidroxi-et-1-il)-amónio, trimetilbenzilamónio, e ainda iões fosfónio, iões sulfónio, de preferência tri- $(C_1-C_4$ -alquil)-sulfónio e iões sulfoxónio, de preferência tri- $(C_1-C_4$ -alquil)-sulfoxónio.

Os aniões de sais de adição ácida utilizáveis são em primeira linha cloreto, brometo, fluoreto, hidrogenossulfato, sulfato, di-hidrogenofosfato, hidrogenofosfato, nitrato, hidrogenocarbonato, carbonato, hexafluorossilicato, hexafluorofosfato, benzoato e os aniões de ácidos C_1-C_4 -alcânicos, de preferência formiato, acetato, propionato e butirato.

Em relação à respectiva utilização das 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I, é dada especial preferência aos seguintes significados dos substituintes, sejam por si só ou em combinação:

Os compostos I, em que R^1 , R^2 representam hidrogénio, alquilo C_1-C_{10} ou C_1-C_6 -haloalquilo, em particular hidrogénio, alquilo C_1-C_6 , C_1-C_4 -haloalquilo, com especial preferência hidrogénio, 1-metilpropilo, isopropilo ou 1,1,1-trifluoro-2-propilo, ou

R^1 e R^2 formam, em conjunto com o átomo de nitrogénio que os liga, um anel de 5 ou 6 elementos, que pode conter um átomo de oxigénio e/ou que pode ter um radical alquilo C_1-C_4 , como, por exemplo, pirrolidin-1-ilo, pirrol-1-ilo,

pirazol-1-ilo, imidazol-1-ilo, piperidin-1-ilo, morfolin-4-ilo, podendo os radicais mencionados ser substituídos por um a três radicais R^a , em particular alquilo C_1-C_4 , como, por exemplo, metilo ou etilo.

Além disso, é igualmente dada particular preferência aos compostos I, em que R^1 significa hidrogénio, alquilo C_1-C_6 e C_1-C_4 -haloalquilo, e R^2 significa hidrogénio.

Também é dada total preferência aos compostos I, em que R^1 e R^2 significam hidrogénio e R^3 significa C_3-C_8 -cicloalquilo, de preferência ciclopropilo, ciclopentilo ou ciclo-hexilo.

Além disso, é dada especial preferência aos compostos I, em que R^3 significa alquilo C_1-C_8 , em particular isopropilo ou n-octilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, com especial preferência ciclopropilo, ciclopentilo ou ciclo-hexilo, ou $CH_2-C_6H_5$.

É sobretudo também dada preferência aos compostos I, em que R^3 significa C_3-C_8 -cicloalquilo, em particular C_3-C_6 -cicloalquilo, com especial preferência ciclopropilo, ciclopropilmetilo, ciclopentilo ou ciclo-hexilo; e X significa ciano, alcoxi C_1-C_4 , por exemplo OCH_3 , C_1-C_4 -haloalquilo, por exemplo CF_3 , ou um fenilalquilo eventualmente substituído por R^a , como, por exemplo, $CH_2-C_6H_5$ ou $CH_2-O-Cl-C_6H_4$.

Além disso, prefere-se em particular os compostos I, em que R^3 significa C_3-C_8 -cicloalquilo, em particular C_3-C_6 -cicloalquilo, com especial preferência ciclopropilo, ciclopentilo ou ciclo-hexilo, e X significa halogéneo, em particular cloro.

Do mesmo modo igualmente preferidos são os compostos I, em que X significa halogéneo, como cloro ou bromo, em particular cloro.

Prefere-se sobretudo os compostos I reunidos nas tabelas que se seguem, no que concerne a utilização dos mesmos. Os grupos mencionados nas tabelas para um substituinte representam ainda, considerados por si, independentemente da combinação em que são mencionados, uma concepção especialmente preferida do substituinte em causa.

Tabela 1

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_3 e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 2

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_2-CH_3 e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 3

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(CH_2)_3-CH_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 4

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH_2-CH(CH_3)_2$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 5

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 6

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 7

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_7\text{-CH}_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 8

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 9

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopentilo e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 10

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclohexilo e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 11

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 12

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-O-Cl-C}_6\text{H}_4$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 13

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_2\text{-CH}_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 14

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 15

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopropil-metilo e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 16

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CN}$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da

tabela A

Tabela 17

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CF}_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 18

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 19

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ e X representa Cl e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 20

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_3 e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 21

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 22

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_3\text{-CH}_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 23

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 24

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 25

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 26

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_7\text{-CH}_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 27

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 28

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopentilo e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 29

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclohexilo e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 30

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH_2-C_6H_5$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 31

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH_2-p-Cl-C_6H_4$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 32

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(CH_2)_2-CH_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 33

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH_2-CH=CH_2$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 34

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopropil-metilo e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a

uma linha da tabela A

Tabela 35

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CN}$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 36

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CF}_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 37

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 38

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ e X representa CF_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 39

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_3 e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 40

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da

tabela A

Tabela 41

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(CH_2)_3-CH_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 42

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH_2-CH(CH_3)_2$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 43

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 44

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $CH(CH_3)_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 45

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(CH_2)_7-CH_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 46

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 47

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopentilo e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 48

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclohexilo e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 49

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 50

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-p-Cl-C}_6\text{H}_4$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 51

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_2\text{-CH}_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e

R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 52

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 53

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopropil-metilo e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 54

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CN}$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 55

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CF}_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 56

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH(CH}_3\text{)-CF}_3$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 57

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ e X representa fenilo e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 58

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_3 e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 59

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 60

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_3\text{-CH}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 61

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 62

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 63

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 64

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 65

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 66

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopentilo e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 67

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclohexilo e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 68

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 69

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-p-Cl-C}_6\text{H}_4$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 70

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_2\text{-CH}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 71

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 72

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopropil-metilo e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 73

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CN}$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 74

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CF}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um

composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 75

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CF}_3$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 76

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ e X representa CN e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 77

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_3 e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 78

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_2-CH_3 e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 79

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_3-\text{CH}_3$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 80

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha

da tabela A

Tabela 81

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 82

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_3$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 83

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 84

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 85

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopentilo e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 86

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclohexilo e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e

R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 87

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 88

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-p-Cl-C}_6\text{H}_4$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 89

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $(\text{CH}_2)_2\text{-CH}_3$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 90

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 91

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa ciclopropil-metilo e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 92

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CN}$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 93

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa CH_2CF_3 e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 94

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

Tabela 95

Os compostos com a fórmula I, em que R^3 representa $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ e X representa OCH_3 e a combinação dos radicais R^1 e R^2 para um composto corresponde por sua vez a uma linha da tabela A

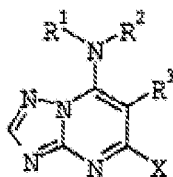


Tabela A

No.	R^1	R^2
A-1	H	H
A-2	CH_2CH_3	H
A-3	CH_2CH_3	CH_3
A-4	CH_2CH_3	CH_2CH_3
A-5	CH_2CF_3	H
A-6	CH_2CF_3	CH_3
A-7	CH_2CF_3	CH_2CH_3
A-8	CH_2CCl_3	H
A-9	CH_2CCl_3	CH_3
A-10	CH_2CCl_3	CH_2CH_3
A-11	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	H
A-12	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_3
A-13	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-14	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-15	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-16	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-17	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-18	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	H
A-19	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_3
A-20	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-21	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	H
A-22	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_3
A-23	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-24	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	H
A-25	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_3
A-26	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_3$	CH_2CH_3
A-27	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-28	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-29	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-30	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-31	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-32	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-33	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
A-34	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
A-35	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_2CH_3
A-36	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H
A-37	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3

(continuação)

No.	R ¹	R ²
A-38	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-42	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-46	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-47	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-48	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-55	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-56	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-64	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-65	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-66	ciclopentilo	H
A-67	ciclopentilo	CH ₃
A-68	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃
A-69	- (CH ₂) ₂ CH (CH ₃) (CH ₂) ₂ -	

As formas de execução particularmente preferidas dos produtos intermediários em relação às variáveis correspondem àquelas dos radicais R¹, R², R^a, R³ e X da fórmula I.

Os compostos I são adequados como fungicidas. Distinguem-se por uma extraordinária eficácia contra um largo espectro de fungos fitopatogénicos, em particular os da classe dos ascomicetes, deuteromicetes, ficomicetes e basidiomicetes. São em parte de eficácia sistémica e podem ser empregues na protecção das plantas como fungicidas das folhas e do solo.

Têm um especial significado no combate a uma multiplicidade de fungos em diversas plantas de cultura, tais como trigo, centeio, cevada, aveia, arroz, milho, relva, bananas, algodão, soja, café, cana do açúcar, vinha, plantas de fruta e plantas decorativas, e plantas hortícolas como pepinos, feijões, tomates, batatas e cucurbitáceas, assim como nas sementes destas plantas.

Adequam-se em especial ao combate às seguintes doenças das plantas:

- espécies *Alternaria*, espécies *Podosphaera*, espécies *Sclerotinia*, *Physalospora canker* nos produtos hortícolas e na fruta,
- *Botrytis cinerea* (podridão cinzenta) nos morangos, produtos hortícolas, plantas decorativas e vinha,
- *Corynespora cassiicola* nos pepinos,
- espécies *Colletotrichum* na fruta e nos produtos hortícolas,
- *Diplocarpon rosae* nas rosas,
- *Elsinoe fawcetti* e *Diaporthe citri* nos citrinos,
- espécies *Sphaerotheca* nas cucurbitáceas, morangos e rosas,
- espécies *Cercospora* nos amendoins, beterrabas e beringelas,

- *Erysiphe cichoracearum* nas cucurbitáceas,
- *Leveillula taurica* nos pimentos, tomates e beringelas,
- Espécies *Mycosphaerella* nas maçãs e nos dióspiros,
- *Phyllactinia kakicola*, *Gloesporium kaki*, nos dióspiros,
- *Gymnosporangium yamadae*, *Leptothyrium pomi*, *Podosphaera leucotricha* e *Gloedes pomigena* nas maçãs,
- *Cladosporium carpophilum* nas pêras e nos dióspiros,
- espécies *Phomopsis* nas pêras,
- espécies *Phytophthora* nos citrinos, batatas, cebolas, em particular *Phytophthora infestans* nas batatas e no tomate,
- *Blumeria graminis* (oídio) nos cereais,
- espécies *Fusarium* e *Verticillium* em diversas plantas,
- *Glomerella cingulata* no chá,
- espécies *Drechslera* e *Bipolaris* nos cereais e no arroz,
- espécies *Mycosphaerella* nas bananas e nos amendoins,
- *Plasmopara viticola* na vinha,
- espécies *Personospora* nas cebolas, espinafres e crisântemo,
- *Phaeoisariopsis vitis* e *Sphaceloma ampelina* nas toranjas,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* no trigo e na cevada,
- espécies *Pseudoperonospora* no lúpulo e nos pepinos,
- espécies *Puccinia* e espécies *Typhula* nos cereais e relva,
- *Pyricularia oryzae* no arroz,

- espécies *Rhizoctonia* no algodão, arroz e relva,
- *Stagonospora nodorum* e *Septoria tritici* no trigo,
- *Uncinula necator* na vinha,
- espécies *Ustilago* nos cereais e na cana do açúcar, e
- espécies *Venturia* (escaras) nas maçãs e nas pêras.

Os compostos I adequam-se ainda ao combate a fungos nocivos, como o *Paecilomyces variotii* na protecção dos materiais (por exemplo, madeira, papel, dispersões para pintar, fibras ou tecidos) e na protecção de mercadorias.

Os compostos I são aplicados ao tratar os fungos ou as plantas, sementes, materiais ou o solo a serem protegidos do ataque fúngico, com uma quantidade de eficácia fungicida das substâncias activas. A aplicação pode ser feita antes ou depois da infecção dos materiais, das plantas ou das sementes pelos fungos.

Os meios fungicidas contêm geralmente entre 0,1 e 95, de preferência entre 0,5 e 90, % em peso de substância activa.

Na aplicação na protecção das plantas, as quantidades de aplicação encontram-se entre 0,01 e 2 kg de substância activa por ha, em função do tipo de efeito pretendido.

No tratamento das sementes, são em geral necessárias quantidades de substância activa de 0,001 a 0,1 g, de preferência de 0,01 a 0,05, g por quilograma de semente.

Na aplicação na protecção de materiais ou de mercadorias, a quantidade de aplicação de substância activa depende do tipo de área de aplicação e do efeito pretendido. As

quantidades de aplicação usuais na protecção de materiais são, por exemplo, de 0,001 g a 2 kg, de preferência de 0,005 g a 1 kg, de substância activa por metro cúbico de material tratado.

Os compostos I podem ser transformados nas formulações usuais, tais como, por exemplo, soluções, emulsões, suspensões, pós, pós finos, pastas e granulados. A forma de aplicação depende do respectivo fim de aplicação. Deverá em todo caso garantir uma distribuição fina e uniforme do composto em conformidade com a invenção.

As formulações são produzidas de forma conhecida, através, por exemplo, do estiramento da substância activa com solventes e/ou substâncias de suporte, caso se pretenda mediante a utilização de emulsionantes e de dispersores, em que, se a água for utilizada como diluente, também se poderá empregar outros solventes orgânicos como solventes auxiliares. Para isso, entram fundamentalmente em linha de conta como substâncias auxiliares: solventes como compostos aromáticos (por exemplo: xileno), compostos aromáticos clorados (ex.: clorobenzóis), parafinas (ex.: fracções de petróleo), álcoois (ex.: metanol, butanol), cetonas (ex.: ciclo-hexanona), aminas (ex.: etanolamina, dimetilformamida) e água; substâncias de suporte como pós de pedra natural (ex.: caulina, aluminas, talco, giz), e pós de pedra sintética (ex.: ácido silícico de elevada dispersão, silicatos); emulsionantes como os emulsionantes não ionogénicos e aniónicos (ex.: éteres de álcoois gordos de polioxi-etileno, sulfonatos de alquilo e sulfonatos de arilo) e dispersores como lixívias de ligninossulfito e celulose de metilo.

As substâncias de actividade superficial tratam-se dos sais alcalinos, alcalino-terrosos ou de amónio de ácidos ligninossulfónico, fenolsulfónico, naftalinossulfónico e dibutilnaftalinossulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilo, sulfatos de álcoois gordos e ácidos gordos e os respectivos sais alcalinos e alcalino-terrosos, sais de éter glicólico de álcool gordo, os produtos de condensação de naftalina sulfonada e de derivados de naftalina com formaldeído, os produtos de condensação da naftalina ou do ácido naftalinossulfónico com fenol e formaldeído, éter polioxietileno-octilfenólico, isooctilfenol, octilfenol ou nonilfenol etoxilado, éter alquilfenol-poliglicólico, éter tributilfenil-poliglicólico, álcoois de poliéteres alquilarílicos, álcool isotridecílico, os condensados de óxido de etileno de álcoois gordos, óleo de rícino etoxilado, éter polioxietilenoalquílico, polioxipropileno etoxilado, acetal de éter poliglicólico do álcool laurílico, éster de sorbitol, lixívias de ligninossulfito e celulose de metilo.

No fabrico de emulsões, pastas, dispersões oleicas ou soluções directamente pulverizáveis, entram em linha de conta fracções de óleo mineral com um ponto de ebulição de médio a elevado, como o querosene ou o óleo Diesel, ainda óleos de alcatrão de hulha, assim como óleos de origem animal ou vegetal, hidrocarbonetos alifáticos, cíclicos e aromáticos, tais como, por exemplo, benzeno, tolueno, xileno, parafina, tetra-hidronaftalina, naftalinas alquiladas ou os respectivos derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, clorofórmio, tetracloreto de carbono, ciclo-hexanol, ciclo-hexanona, clorobenzeno, isoforona, solventes fortemente polares, como, por exemplo,

dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona ou água.

Os pós, meios de espalhamento e de polvilhamento podem ser produzidos através da mistura ou da moagem conjunta das substâncias activas com uma substância de suporte sólida.

Os granulados, por exemplo, os granulados de revestimento, de impregnação e de homogeneização, podem ser usualmente fabricados pela ligação das substâncias activas a substâncias de suporte sólidas. As substâncias de suporte sólidas tratam-se, por exemplo, de terras minerais como gel de sílica, ácidos silícicos, géis siliciosos, silicatos, talco, caulina, *attaclay*, pedra calcária, calcário, giz, *bolus*, loesse, argila, dolomita, diatomito, sulfato de cálcio e sulfato de magnésio, óxido de magnésio, plásticos moídos, e fertilizantes, como, por exemplo, sulfato de amónio, fosfato de amónio, nitrato de amónio, ureias e produtos vegetais, tais como farinha de cereais, pó de casca de árvore, serradura e pó de casca de noz, pó de celulose e outras substâncias de suporte sólidas.

As formulações contêm geralmente entre 0,01 e 95% em peso, de preferência entre 0,1 e 90% em peso, da substância activa. Neste caso, as substâncias activas são empregues com uma pureza de 90% a 100%, de preferência de 95% a 100% (de acordo com o espectro NMR).

Os exemplos de formulações são:

- I. 5 partes de um composto em conformidade com a invenção são misturadas de forma íntima com 95

partes de peso de caulina fina. Obtém-se deste modo um meio em pó que contém 5% em peso da substância activa.

- II. 30 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção são misturadas de forma íntima com uma mistura de 92 partes de peso de gel de ácido silícico em pó e 8 partes de peso de óleo parafínico, que foi pulverizado sobre a superfície deste gel de ácido silícico. Obtém-se deste modo um acabamento da substância activa com um bom poder aderente (23% em peso de teor de substância activa).
- III. 10 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção são dissolvidas numa mistura, composta por 90 partes de peso de xileno, 6 partes de peso do produto de adição de 8 a 10 moles de óxido de etileno a 1 mol de ácido oleico-N-monoetanolamida, 2 partes de peso de sal de cálcio do ácido dodecilbenzenossulfónico e 2 partes de peso do produto de adição de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino (9% em peso de teor de substância activa).
- IV. 20 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção são dissolvidas numa mistura, composta por 60 partes de peso de ciclo-hexanona, 30 partes de peso de isobutanol, 5 partes de peso do produto de adição de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol e 5 partes de peso do produto de adição de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino (16% em peso de teor de substância

activa).

- V. 80 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção são bem misturadas com 3 partes de peso do sal de sódio do ácido diisobutilnaftalino-alfa-sulfônico, 10 partes de peso do sal de sódio de um ácido ligninossulfônico de um lixívia de sulfito e 7 partes de peso de gel de ácido silícico em pó, e moídas num moinho de martelos (80% em peso de teor de substância activa).
- VI. Mistura-se 90 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção com 10 partes de peso de N-metil-a-pirrolidona e obtém-se uma solução adequada à aplicação na forma de pequeníssimas gotículas (90% em peso de teor de substância activa).
- VII. 20 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção são dissolvidas numa mistura composta por 40 partes de peso de ciclo-hexanona, 30 partes de peso de isobutanol, 20 partes de peso do produto de adição de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol, e 10 partes de peso do produto de adição de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino. Através do vazamento e da distribuição fina da solução em 100 000 partes de peso de água, obtém-se uma dispersão aquosa que contém 0,02% em peso da substância activa.
- VIII. 20 partes de peso de um composto em conformidade com a invenção são bem misturadas com 3 partes de peso

do sal de sódio do ácido diisobutilnaftalino-a-sulfónico, 17 partes de peso do sal de sódio de um ácido ligninossulfónico de uma lixívia de sulfito e 60 partes de peso de gel de ácido silícico em pó, e são moídas num moinho de martelos. Através da distribuição fina da mistura em 20 000 partes de peso de água, obtém-se um licor de pulverização que contém 0,1% em peso da substância activa.

As substâncias activas podem ser aplicadas como tais, na forma das respectivas formulações ou nas formas de aplicação preparadas a partir daí, como, por exemplo, na forma de pós, suspensões, dispersões ou soluções directamente pulverizáveis, emulsões, dispersões oleicas, pastas, meios de espalhamento, meios de polvilhamento, granulados; por meio de pulverização, atomização, espalhamento, polvilhamento ou rega. As formas de aplicação dependem totalmente dos fins de utilização. Em todo o caso, deverão garantir uma distribuição o mais fina possível das substâncias activas segundo a invenção.

As formas de aplicação aquosas podem ser preparadas a partir de concentrados de emulsão, de pastas ou de pós reticuláveis (pós de pulverização, dispersões oleicas), através da adição de água. Para o fabrico de emulsões, pastas ou dispersões oleicas, as substâncias podem ser homogeneizadas como tal ou dissolvidas num óleo ou solvente, por meio de reticulantes, adesivantes, dispersores ou emulsionantes, em água. No entanto, também é possível produzir concentrados, que são compostos por substância activa reticulantes, adesivantes, dispersores ou emulsionantes e, eventualmente, solventes ou óleo; concentrados esses que são adequados à diluição com água.

As concentrações de substâncias activas nas preparações prontas a aplicar podem variar dentro de valores amplos. Dum modo geral, encontram-se compreendidas entre 0,0001 e 10%, de preferência entre 0,01 e 1%.

As substâncias activas também podem ser empregues com bom êxito no processo de *ultra-low-volume* (ULV), onde é possível aplicar formulações com mais de 95% em peso de substância activa ou até mesmo a substância activa sem aditivos.

É possível adicionar às substâncias activas óleos de diversos tipos, herbicidas, fungicidas, outros pesticidas, bactericidas, eventualmente também apenas directamente antes da aplicação (tank mix). Estes meios podem ser adicionados por mistura aos meios de acordo com a invenção, numa relação de peso de 1 : 10 a 10 : 1.

Os meios de acordo com a invenção podem encontrar-se na forma de aplicação como fungicidas também em conjunto com outras substâncias activas, como, por exemplo, com herbicidas, insecticidas, reguladores do crescimento, fungicidas ou também com fertilizantes. Aquando da mistura dos compostos I ou dos meios que os contêm na forma de aplicação como fungicidas, obtém-se em muitos casos um aumento do espectro de eficácia fungicida.

A lista que se segue de fungicidas, em conjunto com os quais os compostos de acordo com a invenção podem ser aplicados, deverá descrever as possibilidades de combinação sem com isso as limitarem:

enxofre, ditiocarbamatos e os seus derivados, como

ditiocarbamato de ferridimetilo, ditiocarbamato de zinco-dimetilo, bis-ditiocarbamato de zinco-etileno, bis-ditiocarbamato de manganês-etileno, bis-ditiocarbamato de manganês-zinco-etilenodiamina,, dissulfureto de tetrametiltiurame, complexo de amoníaco de zinco-(N,N-etileno-bis-ditiocarbamato), complexo de amoníaco de zinco-(N,N'-propileno-bis-ditiocarbamato), zinco-(N,N'-propileno-bis-ditiocarbamato), dissulfureto de N,N'-polipropileno-bis-(tiocarbamoílo);

nitroderivados como crotonato de dinitro-(1-metil-heptil)-fenilo, acrilato de 2-sec.-butil-4,6-dinitrofenil-3,3-dimetilo, carbonato de 2-sec.-butil-4,6-dinitrofenilisopropilo, éster de diisopropilo do ácido 5-nitroisoftálico;

substâncias heterocíclicas, como acetato de 2-heptadecil-2-imidazolina, 2-cloro-N-(4'-clorodifenil-2-il)-nicotinamida, 2,4-dicloro-6-(o-cloroanilino)-s-triazina, fosfonotioato de O,O-dietiltalimida, 5-amino-1-[bis-(dimetilamino)-fosfinil]-3-fenil-1,2,4-triazol, 2,3-diciano-1,4-ditioantraquinona, 2-tio-1,3-ditiolo-[4,5-b]-quinoxalina, éster de metilo do ácido 1-(butilcarbamoil)-2-benzimidazolcarbâmico, 2-metoxicarbonilaminobenzimidazol, 2-(furil-(2))-benzimidazol, 2-(tiazolil-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-tetracloroetiltio)-tetra-hidroftalimida, N-triclorometiltiotetra-hidroftalimida, N-triclorometiltioftalimida,

diamida do ácido N-diclorofluorometiltio-N,N'-dimetil-N-fenilsulfúrico, 5-etoxi-3-triclorometil-1,2,3-tiadiazol, 2-tiocianatometiltiobenzotiazol, 1,4-dicloro-2,5-dimetoxibenzeno, 4-(2-clorofenil-hidrazono)-3-metil-5-

isoxazolona, 2-tio-1-óxido de piridina, 8-hidroxiquinolina ou o respectivo sal de cobre, 2,3-diidro-5-carboxanilido-6-metil-1,4-oxatiina, 4,4-dióxido de 2,3-diidro-5-carboxanilido-6-metil-1,4-oxatiina, anilida do ácido 2-metil-5,6-diidro-4H-pirano-3-carboxílico, anilida do ácido 2-metilfurano-3-carboxílico, anilida do ácido 2,5-dimetilfurano-3-carboxílico, anilida do ácido 2,4,5-trimetilfurano-3-carboxílico, ciclo-hexilamida do ácido 2,5-dimetilfurano-3-carboxílico, amida do ácido N-ciclo-hexil-N-metoxi-2,5-dimetilfurano-3-carboxílico, anilida do ácido 2-metilbenzóico, anilida do ácido 2-iodobenzóico, N-formil-N-morfolino-2,2,2-tricloroetilacetal, piperazino-1,4-diil-bis-1-(2,2,2-tricloroetil)-formamida, 1-(3,4-dicloroanilino)-1-formilamino-2,2,2-tricloroetano, 2,6-dimetil-N-tridecilmorfolina ou os seus sais, 2,6-dimetil-N-ciclododecilmorfolina ou os seus sais, N-[3-(p-terc.-butilfenil)-2-metilpropil]-cis-2,6-dimetilmorfolina, N-[3-(p-terc.-butilfenil)-2-metilpropil]-piperidina, 1-[2-(2,4-diclorofenil)-4-etil-1,3-dioxolan-2-iletil]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-diclorofenil)-4-n-propil-1,3-dioxolan-2-iletil]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-propil)-N-(2,4,6-triclorofenoxietil)-N'-imidazol-il-ureia, 1-(4-clorofenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-2-butanona, 1-(4-clorofenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-clorofenil)-2-(4-fluorofenil)-oxiran-2-ilmetil]-1H-1,2,4-triazol, a-(2-clorofenil)-a-(4-clorofenil)-5-pirimidinometanol, 5-butil-2-dimetilamino-4-hidroxi-6-metilpirimidina, bis-(p-clorofenil)-3-piridinometanol, 1,2-bis-(3-etoxicarbonil-2-tioureido)-benzeno, 1,2-bis-(3-metoxicarbonil-2-tioureido)-benzeno,

estrobilurinas, tais como acetato de metil-E-metoxiimino-

[a-(o-toliloxi)-o-tolilo], 3-metoxiacrilato de metil-E-2-{2-[6-(2-cianofenoxi)-pirimidin-4-il-oxi]-fenil}, metil-E-metoxiimino-[a-(2-fenoxifenil)]-acetamida, metil-E-metoxiimino-[a-(2,5-dimetilfenoxi)-o-tolil]-acetamida, 3-metoxiacrilato de metil-E-{2-[trifluorometilpiridil-6]-oximetil]-fenil}, éster de metilo do ácido (E,E)-metoxiimino-{2-[1-(3-trifluorometilfenil)-etilidenoaminooximetil]-fenil}-acético, N-metoxicarbamato de metil-N-(2-{[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]-oximetil}-fenilo),

anilinopirimidinas como N-(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-anilina, N-[4-metil-6-(1-propinil)-pirimidin-2-il]-anilina, N-[4-metil-6-ciclopropilpirimidin-2-il]-anilina,

fenilpirróis como o 4-(2,2-difluoro-1,3-benzodioxol-4-il)-pirrol-3-carbonitrilo,

amidas do ácido cinâmico como a morfolida do ácido 3-(4-clorofenil)-3-(3,4-dimetoxifenil)-acrílico, morfolida do ácido 3-(4-fluorofenil)-3-(3,4-dimetoxifenil)-acrílico,

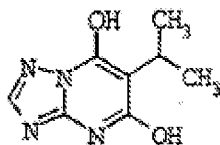
e diversos fungicidas, tais como acetato de dodecilguanidina, 1-(3-bromo-6-metoxi-2-metilfenil)-1-(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)-metanona, 3-[3-(3,5-dimetil-2-oxiciclo-hexil)-2-hidroxietil]-glutarimida, hexaclorobenzeno, (2)-alaninato de DL-metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-furoílo, éster de DL-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(2'-metoxiacetil)-alaninometilo, N-(2,6-dimetilfenil)-N-cloroacetil-D,L-2-aminobutirolactona, éster de DL-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(fenilacetil)-alaninometilo, 5-metil-5-vinil-3-(3,5-diclorofenil)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidina, 3-(3,5-diclorofenil)-5-metil-5-metoximetil-1,3-oxazolidino-

2,4-diona, 3-(3,5-diclorofenil)-1-isopropilcarbamoil-hidantoína, imida do ácido N-(3,5-diclorofenil)-1,2-dimetilciclopropano-1,2-dicarboxílico, 2-ciano-[N-(etilaminocarbonil)-2-metoxiimino]-acetamida, 1-[2-(2,4-diclorofenil)-pentil]-1H-1,2,4-triazol, álcool 2,4-difluoro-a-(1H-1,2,4-triazolil-1-metil)-benzidrílico, N-(3-cloro-2,6-dinitro-4-trifluorometilfenil)-5-trifluorometil-3-cloro-2-aminopiridina, 1-((bis-(4-fluorofenil)-metilsilil)-metil)-1H-1,2,4-triazol, dimetilamida do ácido 5-cloro-2-ciano-4-p-tolilimidazol-1-sulfónico, 3,5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida.

Exemplos de síntese

As prescrições reproduzidas nos exemplos de síntese que se seguem, foram utilizadas mediante a transformação correspondente dos compostos de partida, para obter outros compostos I. Os compostos assim obtidos encontram-se apresentados na tabela que se segue com dados físicos.

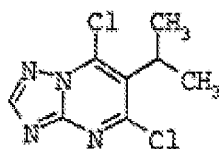
Exemplo 1: Fabrico de 5,7-di-hidroxi-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 14 g (0,17 moles) de 3-amino-1,2,4-triazol, 34,3 g (0,17 moles) de malonato de dietil-2-isopropilo e 50 ml de tributilamina foi agitada durante 6 h nos 180°C. Depois, a mistura de reacção foi arrefecida para os 70°C, adicionou-se uma solução aquosa de hidróxido de sódio (21 g/200 ml de água) e agitou-se a mistura durante 30 min. A

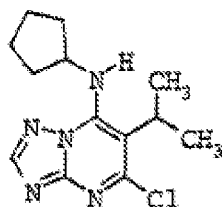
fase orgânica foi separada e a fase aquosa foi extraída com éter dietílico. Em seguida, a fase aquosa foi acidulada com ácido clorídrico conc. e o precipitado que se formou foi colectado por filtração. Depois da secagem, obteve-se 27 g (0,14 moles) de composto de título.

Exemplo 2: Fabrico de 5,7-dicloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 25 g (0,13 moles) de 5,7-dicloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina (ver o exemplo 1) e 50 ml de cloreto de fosforoxi sofreu refluxo durante 8 h. Depois, o cloreto de fosforoxi foi em parte separado por destilação e o resíduo foi embebido numa mistura de cloreto de metileno e água. A fase orgânica foi separada, seca e filtrada. O filtrado foi liberto do solvente. Obteve-se 16 g (0,07 moles) do composto de título (ponto de fusão = 119°C).

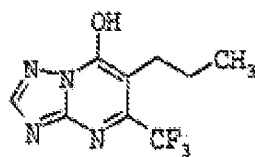
Exemplo 3: Fabrico de 5-cloro-6-isopropil-7-ciclopentilamino-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 0,13 g (1,5 mmoles) de ciclopentilamina, 0,15 g (1,5 mmoles) de trietilamina em 10 ml de cloreto de metileno foi adicionada sob agitação a uma mistura de 0,34

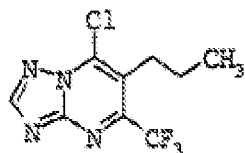
g (1,5 mmoles) de 5,7-dicloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina (ver o exemplo 2) em 20 ml de cloreto de metileno. A mistura de reacção foi agitada à temperatura ambiente durante 16 h e lavada em seguida com ácido clorídrico a 5%. A fase orgânica foi separada, foi seca com sulfato de sódio e filtrada. O filtrado foi liberto do solvente e o resíduo foi purificado por cromatografia. Obteve-se 0,32 g (1,14 mmoles) do composto de título (ponto de fusão = 139°C).

Exemplo 4: Fabrico de 7-hidroxi-6-propil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 14 g (0,17 moles) de 3-amino-1,2,4-triazol, 38,4 g (0,17 moles) de 4,4,4-trifluorobutanoato de 3-oxo-2-propilo e 50 ml de tributilamina foi agitada durante 6 h nos 180°C. O processamento final foi feito em analogia com o exemplo 1. Depois da secagem, obteve-se 33 g (0,13 moles) do composto de título.

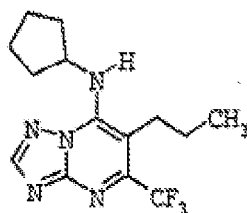
Exemplo 5: Fabrico de 7-cloro-6-propil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 25 g (0,10 moles) de 5,7-dicloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina (ver o exemplo 4) e 50 ml de cloreto de fosforoxi sofreu refluxo

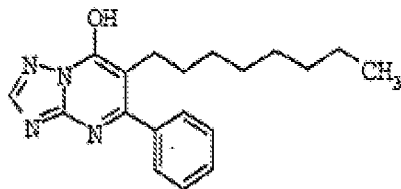
durante 8 h. O processamento final foi feito em analogia com o exemplo 2. Obteve-se 23 g (0,086 moles) do composto de título (ponto de fusão = 63°C).

Exemplo 6: Fabrico de 7-ciclopentilamino-6-propil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 0,13 g (1,5 mmoles) de ciclopentilamina, 0,15 g (1,5 mmoles) de trietilamina em 10 ml de cloreto de metileno foi adicionada sob agitação a uma mistura de 0,40 g (1,5 mmoles) de 7-cloro-6-propil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina (ver o exemplo 5) em 20 ml de cloreto de metileno. A mistura de reacção foi agitada à temperatura ambiente durante 16 h, o processamento final foi feito em analogia com o exemplo 3. Obteve-se 0,39 g (1,24 mmoles) do composto de título (ponto de fusão = 179°C).

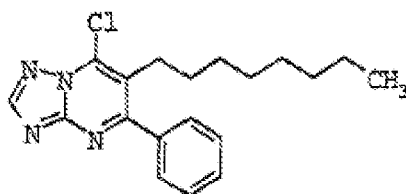
Exemplo 7: Fabrico de 7-hidroxi-6-octil-5-fenil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 14,0 g (0,17 moles) de 3-amino-1,2,4-triazol, 51,7 g (0,17 moles) de butanoato de 3-oxo-2-octil-4-fenilo e 3 g de ácido p-toluenossulfónico sofreu refluxo

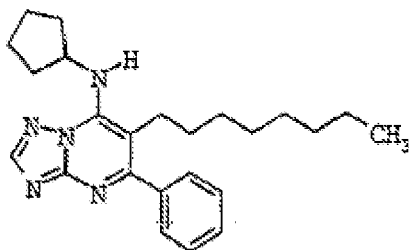
durante 6 h. O processamento final foi feito em analogia com o exemplo 1. Depois da secagem, obteve-se 37 g (0,11 moles) do composto de título.

Exemplo 8: Fabrico de 7-cloro-6-octil-5-fenil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 17 g (0,05 moles) de 7-hidroxi-6-octil-5-fenil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina (ver o exemplo 7) e 50 ml de cloreto de fosforoxi sofreu refluxo durante 8 h. O processamento final foi feito em analogia com o exemplo 2. Obteve-se 16 g (0,046 moles) do composto de título.

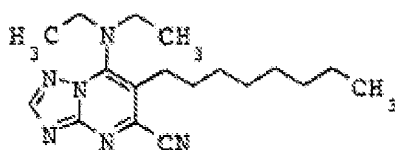
Exemplo 9: Fabrico de 7-ciclopentilamino-6-octil-5-fenil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina



Uma mistura de 0,13 g (1,5 mmoles) de ciclopentilamina e 0,15 g (1,5 mmoles) de trietilamina em 10 ml de cloreto de metileno foi adicionada sob agitação a uma mistura de 0,52 g (1,5 mmoles) de 7-cloro-6-octil-5-fenil-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina (ver o exemplo 8) em 20 ml de cloreto

de metileno. A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente durante 16 h. O processamento final foi feito em analogia com o exemplo 3. Obteve-se 0,52 g (1,3 mmoles) do composto de título (ponto de fusão = 81°C).

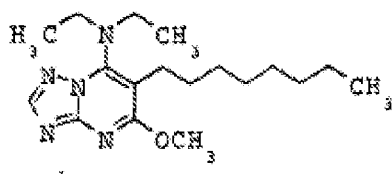
Exemplo 10: Fabrico de 5-ciano-6-octil-7-dietilamino-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina [I-167]



Uma mistura de 0,1 moles do composto I-48 e 0,25 moles de cianeto de tetraetilamônio em 750 ml de dimetilformamida foi agitada durante cerca de 16 horas nos 20 - 25°C. Depois da adição de água e de éter metil-terc.-butílico, as fases foram separadas. A fase orgânica foi liberta do solvente depois da lavagem com água e da secagem. A partir do resíduo obteve-se, após cromatografia em gel silicioso, 8,33 g do composto de título.

$^1\text{H-NMR}$: δ em ppm: 8,5 (s); 3,65 (q); 2,9 (m); 1,7 (m); 1,3 (m); 1,2 (t); 0,9 (t).

Exemplo 11: Fabrico de 5-metoxi-6-octil-7-dietilamino-[1,2,4]-triazolo-[1,5- α]-pirimidina [I-168]



Uma solução de 65 mmoles do composto I-48 em 400 ml de metanol anidro, foi misturada nos 20 - 25°C com 71,5 mmoles

de uma solução a 30% de metanolato de sódio, foi depois agitada durante cerca de 16 horas nos 20 - 25°C. Depois da separação por destilação do solvente, o resíduo foi deitado em diclorometano. Esta solução foi lavada com água, depois seca e liberta do solvente. Depois de cromatografia em gel silicioso, obteve-se 7,5 g do composto de título.

$^1\text{H-NMR}$: δ em ppm: 8,18 (s); 4,09 (s); 3,41 (q); 2,65 (m); 1,55 (m); 1,3 (m); 1,1 (t); 0,9 (t).

Tabela 1

Nº.	R ¹	R ²	R ³	X	Dados físicos (p.f. [°C]: IR[cm ⁻¹]; $^1\text{H-NMR}$ δ [ppm])
I-1	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	Cl	169
I-2	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₃	Cl	125
I-3	ciclopentilo	H	CH ₃	Cl	172
I-4	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₃	Cl	96
I-5	CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₃	Cl	209
I-6	CH ₂ -CF ₃	H	CH ₃	Cl	133
I-7	CH ₃ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	55
I-8	CH(CH ₃) ₂		CH ₂ -CH ₃	Cl	152
I-9	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -CH ₃	Cl	1543, 1521, 1451
I-10	ciclopentilo	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	136
I-11	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1596, 1511, 1464
I-12	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1595, 1511, 1456
I-13	CH(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂ -CH ₃	Cl	1593, 1513, 1097
I-14	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	145
I-15	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-16	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-17	(R/S) CH(CH ₃)-CH (CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	119
I-18	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	102
I-19	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	102
I-20	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	116
I-21	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	1513, 1555, 1464
I-22	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	1512, 1554, 1464
I-23	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	169
I-24	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-25	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140

(continuação)

No.	R ¹	R ²	R ³	X	Dados físicos (p.f. [°C]; IR[cm ⁻¹]; ¹ H-NMR δ [ppm])
I-26	H	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	263
I-27	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	91
I-28	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	125
I-29	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	121
I-30	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	121
I-31	CH ₂ -CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	156
I-32	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	180
I-33	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	127
I-34	ciclopentilo	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	56
I-35	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	163
I-36	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	159
I-37	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	180
I-38	ciclopentilo	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	127
I-39	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	56
I-40	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	163
I-41	CH ₂ -CF ₃	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	159
I-42	CH(CH ₃) ₂	H	C(CH ₃) ₃	Cl	136
I-43	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		C(CH ₃) ₃	Cl	140
I-44	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1597, 1508, 1462
I-45	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1553, 1464
I-46	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2925, 1594, 1520, 1192
I-47	ciclopentilo	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1612, 1554, 1059
I-48	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1598, 1511, 1466
I-49	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₂	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1597, 1561, 1457
I-50	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1595, 1514, 1467
I-51	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1553, 1464
I-52	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1612, 1553, 1464
I-53	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1612, 1552, 1463
I-54	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1556, 1464
I-55	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1556, 1467
I-56	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2925, 1612, 1556, 1466
I-57	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	1619, 1533, 1146
I-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	1620, 1542, 1146
I-59	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	1619, 1541, 1146
I-60	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	71
I-61	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	180

(continuação)

No.	R ¹	R ²	R ³	X	Dados físicos (p.f. [°C], IR[cm ⁻¹]; ¹ H-NMR δ [ppm])
I-62	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	91
I-63	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	1592, 1506, 1454
I-64	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	85
I-65	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	1616, 1544, 1463
I-66	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	160
I-67	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	160
I-68	(R/S) CH(CH ₃)-CH (CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	134
I-69	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	120
I-70	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	120
I-71	(R/S) CH(CH ₃)-O(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	2964, 1611, 1551
I-72	(R) CH(CH ₃)-O(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	64
I-73	(S) CH(CH ₃)-O(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	64
I-74	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	1616, 1527, 1147
I-75	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	70
I-76	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	70
I-77	H	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	271
I-78	CH ₂ -O(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	ciclopentilo	Cl	66
I-79	CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	136
I-80	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	ciclopentilo	Cl	78
I-81	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	ciclopentilo	Cl	87
I-82	CH ₂ -O(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	ciclopentilo	Cl	136
I-83	CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	156
I-84	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		ciclopentilo	Cl	151
I-85	ciclopentilo	H	ciclopentilo	Cl	158
I-86	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	ciclopentilo	Cl	103
I-87	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	ciclopentilo	Cl	139
I-88	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	ciclopentilo	Cl	134
I-89	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciclopentilo	Cl	155
I-90	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciclopentilo	Cl	155
I-91	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciclopentilo	Cl	155
I-92	(R/S) CH(CH ₃)-CH (CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	114
I-93	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	110
I-94	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	110
I-95	(R/S) CH(CH ₃)-O(CH ₃) ₃	H	ciclopentilo	Cl	134
I-96	(R) CH(CH ₃)-O(CH ₃) ₃	H	ciclopentilo	Cl	116

(continuação)

No.	R ¹	R ²	R ³	X	Dados físicos (p.f. [°C]; IR[cm ⁻¹]; ¹ H-NMR δ [ppm])
1-97	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciclopentilo	Cl	115
1-98	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	160
1-99	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	130
1-100	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	130
1-101	CH ₂ -CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	167
1-102	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	144
1-103	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -(2-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	114
1-104	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -(2-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	164
1-105	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	55
1-106	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	37
1-107	ciclopentilo	H	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	43
1-108	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo-metilo	Cl	150
1-109	CH ₂ -CF ₃	H	ciclopentilo-metilo	Cl	144
1-110	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₂ -CN	Cl	211
1-111	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	84
1-112	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	151
1-113	ciclopentilo	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	163
1-114	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	103
1-115	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	107
1-116	CH ₂ (CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	88
1-117	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	131
1-118	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	126
1-119	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	126
1-120	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	114
1-121	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	112
1-122	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	112
1-123	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	110
1-124	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	105
1-125	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	105
1-126	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	179
1-127	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	125
1-128	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	125
1-129	H	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	243
1-130	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	91
1-131	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	64
1-132	ciclopentilo	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	84

(continuação)

No.	R ¹	R ²	R ³	X	Dados físicos (p.f. [°C]; IR[cm ⁻¹]; ¹ H-NMR δ [ppm])
I-133	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	177
I-134	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	162
I-135	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	158
I-136	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	161
I-137	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	161
I-138	H	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	241
I-139	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	83
I-140	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	63
I-141	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	163
I-142	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		ciclopentilo	Cl	2960, 1610, 1550, 1241
I-143	ciclopentilo	H	ciclopentilo	Cl	154
I-144	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	ciclopentilo	Cl	2958, 1610, 1548, 1239
I-145	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciclopentilo	Cl	143
I-146	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciclopentilo	Cl	137
I-147	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciclopentilo	Cl	137
I-148	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	124
I-149	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	110
I-150	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciclopentilo	Cl	110
I-151	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciclopentilo	Cl	113
I-152	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciclopentilo	Cl	2982, 1610, 1550, 1241
I-153	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciclopentilo	Cl	2960, 1610, 1548, 1241
I-154	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	129
I-155	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	135
I-156	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciclopentilo	Cl	135
I-157	H	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -CH ₃	CF ₃	129
I-158	H	H	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	CF ₃	213
I-159	H	H	(CH ₂) ₈ -CH ₃	CF ₃	180
I-160	H	H	(CH ₂) ₅ -CH ₃	CF ₃	208
I-161	H	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH ₃	CF ₃	162
I-162	H	H	CH(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	CF ₃	164
I-163	H	H	CH(CH ₃)-CH ₂) ₃ -CH ₃	CF ₃	146
I-164	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	277
I-165	H	H	ciclopentilo	Cl	8,4(s); 8,2(m); 3,45(m); 1,95(m); 8,2(m); 3,45(m);
I-166	H	H	ciclopentilo	Cl	8,45(s); 8,2(m); 3,1(m); 2,1(m); 1,9(m); 1,55(m); 1,4 (m)
I-167	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CN	ver exemplo 10
I-168	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	OCH ₃	ver exemplo 11

Exemplos da acção contra fungos nocivos

A acção fungicida dos compostos com a fórmula geral I pode ser mostrada pelas seguintes experiências:

As substâncias activas foram preparadas em separado ou em conjunto na forma de emulsão a 10%, numa mistura de 70% em peso de ciclo-hexanona, 20% em peso de Nekanil® LN (Lutensol® AP6, reticulante com acção emulsionante e dispersora à base de alquilfenóis etoxilados) e 10% em peso de Wettol® EM (emulsionante não iónico à base de óleo de rícino etoxilado) e são diluídas com água em conformidade com a concentração pretendida.

Exemplo de aplicação 1: Eficácia contra o *Botrytis cinerea* nas folhas de pimento

Plântulas de pimento da variedade "Neusiedler Ideal Elite" foram pulverizadas - depois de se terem desenvolvido bem 4 a 5 folhas - com uma preparação aquosa de substância activa, preparada a partir de um solução-mãe de 10% de substância activa, 85% de ciclo-hexanona e 5% de emulsionante, até à molhagem com gotas. No dia seguinte, as plantas tratadas foram inoculadas com uma suspensão de esporos do *Botrytis cinerea*, que continha $1,7 \times 10^6$ esporos/ml numa solução de biomalte aquosa a 2%. Em seguida, as plantas da experiência foram colocadas numa câmara climatizada com 22 a 24°C e com uma elevada humidade do ar. Passados 5 dias, foi possível determinar visualmente o grau do ataque fúngico nas folhas em %.

Neste teste, as plantas tratadas com 250 ppm das

substâncias activas I-10, I-61, I-65, I-66, I-68, I-69, I-76, I-78, I-84, I-100, I-101, I-146 e I-153 a I-155 mostravam nenhum ataque ou um ataque até 15%, enquanto que as plantas não tratadas tinham sofrido um ataque até 90%.

Exemplo de aplicação 2: Eficácia contra o *Peronospora* das vides (*Plasmopara viticola*)

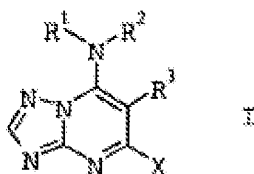
As folhas de vides envasadas da variedade "Müller-Thurgau" foram pulverizadas com preparação aquosa de substância activa, preparada com uma solução-mãe de 10% de substância activa, 85% de ciclo-hexanona e 5% de emulsionante, até à molhagem por gotas. No dia seguinte, inoculou-se as folhas com uma suspensão aquosa de zoósporos de *Plasmopara viticola*. Em seguida, as vides foram primeiro colocadas durante 48 horas numa câmara saturada com vapor de água nos 24°C e, depois, durante 5 dias na estufa, a temperaturas entre 20 e 30°C. Depois deste período de tempo, as plantas foram de novo colocadas durante 16 horas numa câmara húmida, para acelerar a ruptura do veículo de esporângios. Depois, determinou-se visualmente a dimensão da evolução do ataque nas partes inferiores das folhas.

Neste teste, as plantas tratadas com 250 ppm das substâncias activas I-8 a I-10, I-19, I-25, I-27, I-49, I-60 a I-62, I-69, I-84, I-101, I-113, I-133, I-146, e I-153 a I-155 mostravam nenhum ataque ou um ataque até 15%, enquanto que as plantas não tratadas tinham sofrido um ataque até 85%.

Lisboa, 30 de Abril de 2007

REIVINDICAÇÕES

1. 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I,



em que os substituintes têm os seguintes significados:

R^1 , R^2 hidrogénio, alquilo C_1-C_{10} , alcenilo C_2-C_{10} ,
alcinilo C_2-C_{10} , C_3-C_8 -cicloalquilo, fenilo,
naftilo; ou

heterociclilo de 5 ou 6 elementos contendo um a
quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos
de nitrogénio e um átomo de enxofre ou um átomo
de oxigénio; ou

heteroarilo de 5 ou 6 elementos, contendo um a
quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos
de nitrogénio e um átomo de enxofre ou um átomo
de oxigénio,

podendo R^1 e R^2 , se diferentes de hidrogénio e
independentemente um do outro, ser parcial ou
totalmente halogenados, e/ou ter um a três
radicais do grupo R^a ;

R^a ciano, nitro, hidroxí, alquilo C_1-C_6 , C_1-C_6 -
haloalquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, alcoxi C_1-C_6 ,
 C_1-C_6 -haloalcoxi, C_1-C_6 -alquiltio, C_1-C_6 -

alquilamina, di-C₁-C₆-alquilamina, alcenilo C₂-C₆, C₂-C₆-alceniloxi, alcinilo C₂-C₆, C₃-C₆-alciniloxi e oxi-C₁-C₄-alcilenoxi eventualmente halogenado; ou

R¹ e R² podem formar, juntamente com o átomo de nitrogénio que os liga, um anel de 5 ou 6 elementos, que contém um a quatro átomos de nitrogénio ou um a três átomos de nitrogénio e um átomo de enxofre ou um átomo de oxigénio, e que pode ser substituído por um a três radicais do grupo R^a;

R³ alquilo C₁-C₁₀, alcenilo C₂-C₁₀, alcinilo C₂-C₁₀, C₃-C₈-cicloalquilo, fenil-C₁-C₁₀-alquilo,

podendo R³ ser não substituído ou ser parcial ou totalmente halogenado e/ou ter um a três radicais do grupo R^a, ou

C₁-C₁₀-haloalquilo, que pode ter um a três radicais do grupo Ra;

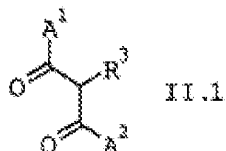
X halogéneo, ciano, alcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-haloalquilo, fenilo ou fenilo substituído por R^a;

e os respectivos sais.

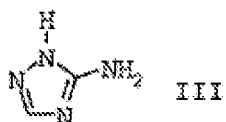
2. 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I de acordo com a reivindicação 1, em que X representa halogéneo.

3. Processo para o fabrico de 7-aminotriazolopirimidinas

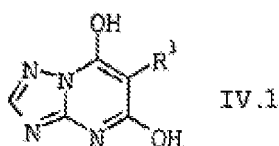
com a fórmula I de acordo com a reivindicação 1, em que X representa halogéneo, ciano ou alcoxí C₁-C₄, caracterizado pelo facto de ciclizar-se os compostos dicarbonilo com a fórmula II.1



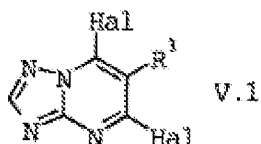
em que A¹ e A² representam alcoxí C₁-C₁₀, com o 3-amino-1,2,4-triazol com a fórmula III



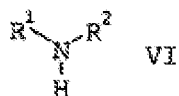
nas hidroxitriazolopirimidinas com a fórmula IV.1



de halogenar-se as hidroxitriazolopirimidinas com a fórmula IV.1 com um meio de halogenação, nas halogenotriazolopirimidinas com a fórmula V.1



em que Hal representa halogéneo, e transformar-se depois com uma amina com a fórmula VI



nas 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I, em que X significa halogéneo, e de proceder-se a transformação

para o fabrico das 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I, em que X significa ciano ou alcoxi C₁-C₄, com um composto com a fórmula VII



em que M significa um catião de amónio, de tetraalquilamónio, de metal alcalino ou de metal alcalino-terroso, e X' significa ciano ou alcoxi.

4.

(5-cloro-6-etil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-ciclopentilamina;
 (5-cloro-6-etil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-(S)-(1,2-dimetilpropil)-amina;
 (5-cloro-6-etil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-(S)-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil)-amina;
 6-butil-5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidina;
 (5-cloro-6-octil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-dipropilamina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-(2-metilalil)-amina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-isopropilamina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-dietilamina;
 (R/S)-sec.-butil-(5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-amina;
 (R)-sec.-butil-(5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-il)-amina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-

pirimidin-7-il)-(R/S)-(1,2-dimetilpropil)-amina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(R)-(1,2-dimetilpropil)-amina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(S)-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil)-
 amina;
 (5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-etil-(2-metilalil)-amina;
 (5-cloro-6-ciclo-hexil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(S)-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil)-
 amina;
 (5-cloro-6-ciclo-hexil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-etilamina;
 [5-cloro-6-(2,2,2-trifluoroetil)-[1,2,4]-triazolo-
 [1,5-a]-pirimidin-7-il]-ciclopentilamina;
 6-octil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-amina;
 Sec.-butil-(5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-
 [1,5-a]-pirimidin-7-il)-amina;
 (5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(R)-(1,2,2-trimetilpropil)-amina;
 (5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(R/S)-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil)-
 amina;
 (5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(S)-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil)-
 amina.

5.

(5-cloro-6-isobutil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(2-metilalil)-amina;
 (5-cloro-6-isobutil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-

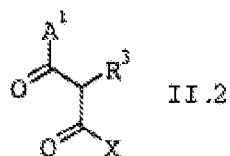
pirimidin-7-il)-isopropilamina;
 sec.-butil-(5-cloro-6-isobutil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-amina;
 (5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-isopropilamina;
 5-cloro-6-ciclo-hexil-7-(4-metilpiperidin-1-il)-
 [1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidina;
 (5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-ciclopentilamina;
 (5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-il)-(R/S)-(1,2,2-trimetilpropil)-amina.

6.

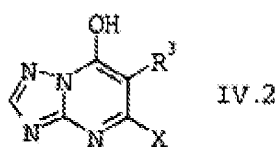
6-isobutil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-ilamina;
 6-(1-metilbutil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-
 [1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-terc.-butil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-ilamina;
 6-isopropil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-ilamina;
 6-ciclopentil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-ilamina;
 6-ciclo-hexil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-ilamina;
 6-benzil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-
 pirimidin-7-ilamina;
 6-(4-clorobenzil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-
 [1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 5-cloro-6-etil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-
 ilamina;
 5-cloro-6-isopropil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-

7-ilamina;
 5-cloro-6-(2,2,2-trifluoroetil)-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-propil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-(1-metil-heptil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-(4-metilpentil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-heptil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-hexil-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-(1-etilpentil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-(1-propilbutil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 6-(1-metilpentil)-5-trifluorometil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 5-cloro-6-octil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 5-cloro-6-ciclopentil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina;
 5-cloro-6-ciclo-hexil-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidin-7-ilamina.

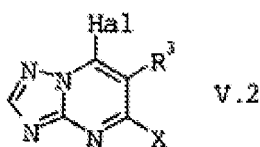
7. Processo para o fabrico dos compostos com a fórmula I de acordo com a reivindicação 1, em que X significa C₁-C₄-haloalquilo ou fenilo eventualmente substituído por R^a, caracterizado pelo facto de ciclizar-se os compostos dicarbonilo com a fórmula II.2



em que A¹ representa alcoxi C₁-C₁₀ e X representa C₁-C₄-haloalquilo ou fenilo eventualmente substituído por R^a, com o 3-amino-1,2,4-triazol com a fórmula III de acordo com a reivindicação 3, nas 7-hidroxitriazolopirimidinas com a fórmula IV.2



de halogenar-se as 7-hidroxitriazolopirimidinas com a fórmula IV.2 com um meio de halogenação, nas 7-halogenotriazolopirimidinas com a fórmula V.2



em que Hal representa halogéneo, e transformar-se depois com uma amina com a fórmula VI de acordo com a reivindicação 3, nas 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula I.

8. Meio adequado ao combate a fungos nocivos, o qual contém uma substância de suporte sólida ou líquida e uma 7-aminotriazolopirimidina com a fórmula geral I de acordo com a reivindicação 1.
9. Utilização das 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula geral I de acordo com a reivindicação 1, no fabrico de um meio adequado ao combate a fungos nocivos.

10. Processo para o combate a fungos nocivos, caracterizado pelo facto de tratar-se os fungos ou os materiais, plantas, o solo ou as sementes a serem protegidos do ataque fúngico, com uma quantidade eficaz das 7-aminotriazolopirimidinas com a fórmula geral I de acordo com a reivindicação 1.

Lisboa, 30 de Abril de 2007