

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
06. Januar 2022 (06.01.2022)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2022/002838 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 401/14 (2006.01) A01N 43/50 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01) A01N 43/80 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2021/067667

(22) Internationales Anmeldedatum:
28. Juni 2021 (28.06.2021)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
20183158.3 30. Juni 2020 (30.06.2020) EP

(71) Anmelder: **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT**
[DE/DE]; Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen
(DE).

(72) Erfinder: **MCLEOD, Michael Charles**; Schulstraße 54,
60594 Frankfurt (DE). **BRAUN, Ralf**; Bischof-Beck-Stras-
se 1a, 76857 Ramberg (DE). **JAKOBI, Harald**; Großer
Hasenpfad 80, 60598 Frankfurt (DE). **SCHNATTERER,**
Stefan; Schillerring 10, 65795 Hattersheim (DE). **MEIS-**
TER, Catherine Simone; Graefstrasse 80, 60486 Frankfurt
am Main (DE). **SCHMUTZLER, Dirk**; Hauptmannweg 2,
65795 Hattersheim (DE). **MACHETTIRA, Anu Bheemai-**
ah; Niedernhausener strasse 47, 60326 Frankfurt am Main
(DE). **ASMUS, Elisabeth**; Kirchenstraße 25, 63768 Hös-
bach (DE). **ROSINGER, Christopher Hugh**; Am Hoch-
feld 33, 65719 Hofheim (DE). **GATZWEILER, Elmar**;
Am Nauheimer Bach 22, 61231 Bad Nauheim (DE). **REIN-**
GRUBER, Anna Maria; Pestalozzistraße 2, 64646 Hep-
penheim (DE). **DITTGEN, Jan**; Burgstraße 26, 60316
Frankfurt (DE). **BOLLENBACH-WAHL, Birgit**; Duhl-
wiesen 3, 55413 Weiler/Bingen (DE).

(74) Anwalt: **BIP PATENTS**; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789
Monheim am Rhein NRW (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY,
BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM,
DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,

HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA,
MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU,
RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST,
SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ,
RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ,
DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT,
LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI,
SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

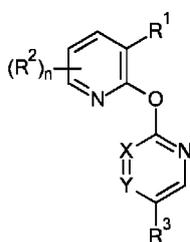
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz
3)

(54) Title: SUBSTITUTED HETEROARYLOXYPYRIDINES, THE SALTS THEREOF AND THEIR USE AS HERBICIDAL AGENTS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE HETEROARYLOXYPYRIDINE SOWIE DEREN SALZE UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE WIRKSTOFFE



(57) Abstract: The invention relates to substituted heteroaryloxy pyridines of the general formula (I) and to their use as herbicides, in particular for controlling weeds and/or weed grasses in crops of cultivated plants and/or as plant growth regulators for influencing the growth of crops of cultivated plants. The present invention also relates to herbicidal and/or plant growth-controlling agents comprising one or more compounds of the general formula (I).

(57) Zusammenfassung: Es werden substituierte Heteroaryloxy pyridine der allgemeinen Formel (I) beschrieben sowie deren Verwendung als Herbizide, insbesondere zur Bekämpfung von Unkräutern und/oder Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen und/oder als Pflanzenwachstumsregulatoren zur Beeinflussung des Wachstums von Nutzpflanzenkulturen. Die vorliegende Erfindung betrifft ferner herbizide und/oder pflanzenwachstumsregulierende Mittel umfassend eine oder mehrere Verbindungen der allgemeinen Formel (I).



WO 2022/002838 A1

Bayer AG

Substituierte Heteroaryloxypyridine sowie deren Salze und ihre Verwendung als herbizide Wirkstoffe

5 Beschreibung

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Pflanzenschutzmittel, insbesondere das der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

10 Speziell betrifft diese Erfindung substituierte Heteroaryloxypyridine sowie deren Salze, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Bisher bekannte Pflanzenschutzmittel zur selektiven Bekämpfung von Schadpflanzen in Nutzpflanzenkulturen oder Wirkstoffe zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs weisen bei
15 ihrer Anwendung teilweise Nachteile auf, sei es, dass sie (a) keine oder aber eine unzureichende herbizide Wirkung gegen bestimmte Schadpflanzen, (b) ein zu geringes Spektrum der Schadpflanzen, das mit einem Wirkstoff bekämpft werden kann, (c) zu geringe Selektivität in Nutzpflanzenkulturen und/oder (d) ein toxikologisch ungünstiges Profil besitzen. Weiterhin führen manche Wirkstoffe, die als Pflanzenwachstumsregulatoren bei einigen Nutzpflanzen eingesetzt werden können, bei anderen
20 Nutzpflanzen zu unerwünscht verminderten Ernteerträgen oder sind mit der Kulturpflanze nicht oder nur in einem engen Aufwandmengenbereich verträglich. Einige der bekannten Wirkstoffe lassen sich wegen schwer zugänglicher Vorprodukte und Reagenzien im industriellen Maßstab nicht wirtschaftlich herstellen oder besitzen nur unzureichende chemische Stabilitäten. Bei anderen Wirkstoffen hängt die Wirkung zu stark von Umweltbedingungen, wie Wetter- und Bodenverhältnissen ab.

25

Die herbizide Wirkung dieser bekannten Verbindungen, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen, bzw. deren Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen bleibt verbesserungswürdig.

In der WO 2016/149315 sind verschiedene 3-Pyrimidylloxypyridine als Herbizide beschrieben.

30

WO 2020/002089 beschreibt verschiedene 2-Heteroaryloxypyridine mit herbizider Wirkung, die in der 3-Position des Pyridins als Substituenten einen Ring tragen, der über eine 1-Atom-Brücke an das Pyridin gebunden ist.

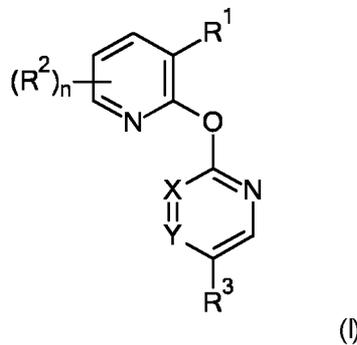
35

In der WO 2004/035564 sind verschiedene 2-Heteroaryloxypyridine als Herbizide beschrieben, die in der 3-Position des Pyridines mit Pyrazolylresten substituiert sind. 2-Heteroaryloxypyridine, die in der 3-

Position des Pyridines mit anderen 5-Ring-Heterocyclen substituiert sind, und deren Salze sind dagegen noch nicht beschrieben.

Überraschenderweise wurde nun gefunden, dass bestimmte 2-Heteroaryloxyipyridine und/oder deren Salze als herbizide Wirkstoffe besonders gut geeignet sind.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind damit substituierte Heteroaryloxyipyridine der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze



10 worin

R^1 für ein gegebenenfalls substituiertes 5-Ring-Heteroaryl steht, das optional mit bis zu 3 Substituenten, unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe R^4 , substituiert ist,

15 R^2 unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, Formamid, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Haloalkenyl, (C₂-C₄)-Haloalkynyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkenyloxy, (C₁-C₄)-Alkinyloxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₃-C₆)-Cycloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylcarbonyl, Carboxyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₂-C₆)-Dialkylaminocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonylamino, (C₂-C₆)-Cycloalkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonylamino, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonylamino, (C₂-C₆)-Dialkylaminocarbonylamino, Carboxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminosulfonyl, (C₂-C₆)-Dialkylaminosulfonyl oder (C₃-C₆)-Trialkylsilyl steht,

20
25
30

n ist gleich 0, 1, 2, oder 3,

R³ für Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Haloalkyl steht,

5 R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxythiocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₆)-cycloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkyoxy-(C₁-C₄)-alkyl steht,

10 X für N oder CR⁵ steht,

Y für N oder CH steht,

und

15

R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder Cyano steht,

ausgenommen Verbindungen, in denen R¹ für ein unsubstituiertes oder substituiertes 3-Pyrazol steht.

20 Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise Mineralsäuren, wie beispielsweise HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ oder HNO₃, oder organische Säuren, z. B. Carbonsäuren, wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Milchsäure oder Salicylsäure oder Sulfonsäuren, wie zum Beispiel *p*-Toluolsulfonsäure, an eine basische Gruppe, wie z.B. Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Piperidino, 25 Morpholino oder Pyridino, Salze bilden. Diese Salze enthalten dann die konjugierte Base der Säure als Anion. Geeignete Substituenten, die in deprotonierter Form, wie z.B. Sulfonsäuren, bestimmte Sulfonsäureamide oder Carbonsäuren, vorliegen, können innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie Aminogruppen bilden. Salzbildung kann auch durch Einwirkung einer Base auf Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erfolgen. Geeignete Basen sind beispielsweise organische 30 Amine, wie Trialkylamine, Morpholin, Piperidin und Pyridin sowie Ammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate und -hydrogencarbonate, insbesondere Natrium- und Kaliumhydroxid, Natrium- und Kaliumcarbonat und Natrium- und Kaliumhydrogencarbonat. Diese Salze sind Verbindungen, in denen der azide Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird, beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder 35 Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze, Salze mit organischen Aminen oder quartäre Ammoniumsalze, zum Beispiel mit Kationen der Formel [NR^aR^bR^cR^d]⁺, worin R^a bis R^d jeweils unabhängig voneinander einen organischen Rest, insbesondere

Alkyl, Aryl, Arylalkyl oder Alkylaryl darstellen. Infrage kommen auch Alkylsulfonium- und Alkylsulfoxoniumsalze, wie (C₁-C₄)-Trialkylsulfonium- und (C₁-C₄)-Trialkylsulfoxoniumsalze.

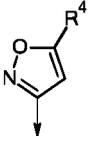
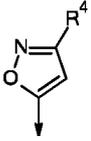
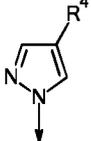
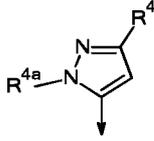
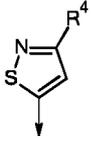
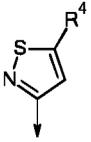
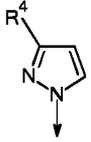
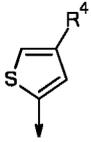
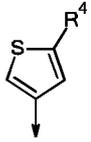
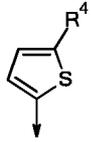
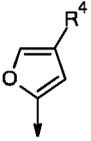
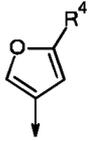
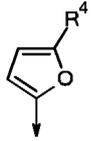
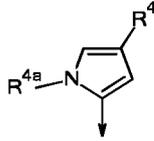
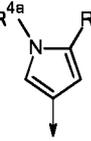
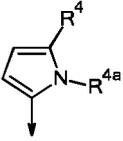
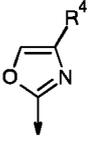
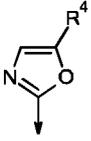
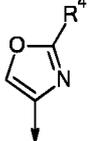
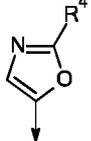
Die erfindungsgemäß substituierten Heteroaryloxyppyridine der allgemeinen Formel (I) können in Abhängigkeit von äußeren Bedingungen, wie pH-Wert, Lösungsmittel und Temperatur eventuell in verschiedenen tautomeren Strukturen vorliegen, die alle von der allgemeinen Formel (I) umfasst sind.

Im Folgenden werden die erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen der Formel (I) und ihre Salze als "Verbindungen der allgemeinen Formel (I)" bezeichnet.

10

Bevorzugter Erfindungsgegenstand sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

R¹ für die Gruppen R¹-1 bis R¹-42 steht:

				
R ¹ -1	R ¹ -2	R ¹ -3	R ¹ -4	R ¹ -5
				
R ¹ -6	R ¹ -7	R ¹ -8	R ¹ -9	R ¹ -10
				
R ¹ -11	R ¹ -12	R ¹ -13	R ¹ -14	R ¹ -15
				
R ¹ -16	R ¹ -17	R ¹ -18	R ¹ -19	R ¹ -20

R ¹ -21	R ¹ -22	R ¹ -23	R ¹ -24	R ¹ -25
R ¹ -26	R ¹ -27	R ¹ -28	R ¹ -29	R ¹ -30
R ¹ -31	R ¹ -32	R ¹ -33	R ¹ -34	R ¹ -35
R ¹ -36	R ¹ -37	R ¹ -38	R ¹ -39	R ¹ -40
R ¹ -41	R ¹ -42			

R² unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, Formamid, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Haloalkenyl, (C₂-C₄)-Haloalkynyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkenyloxy, (C₁-C₄)-Alkinyloxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₃-C₆)-Cycloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylcarbonyl, Carboxyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₂-C₆)-Dialkylaminocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonylamino, (C₂-C₆)-Cycloalkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonylamino oder (C₃-C₆)-Trialkylsilyl steht,

n ist gleich 0, 1, oder 2,

R³ für Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Haloalkyl steht,

5

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxythiocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₆)-cycloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl steht,

10

R^{4a} für Wasserstoff oder (C₁-C₂)-Alkyl steht,

X für N oder CR⁵ steht,

15 Y für N oder CH steht,

und

R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder Cyano steht.

20

Besonders bevorzugter Erfindungsgegenstand sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

R¹ für die Gruppen R¹⁻¹ bis R¹⁻⁶ steht,

25 R² unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio oder (C₁-C₄)-Alkylcarbonylamino steht,

n ist gleich 0, 1, oder 2,

30

R³ für Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₂)-Alkyl oder (C₁-C₂)-Haloalkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxythiocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₆)-cycloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl steht,

35

R^{4a} für Wasserstoff oder (C₁-C₂)-Alkyl steht,

X für N oder CR⁵ steht,

5 Y für N oder CH steht,

und

R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder Cyano steht.

10

Ganz besonders bevorzugter Erfindungsgegenstand sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I),
worin

R¹ für die Gruppen R¹-1 bis R¹-3 steht,

15

R² unabhängig voneinander für Halogen, Amino, Cyano, (C₁-C₂)-Alkyl, (C₁-C₂)-Haloalkyl oder
Vinyl steht,

n ist gleich 0, 1, oder 2,

20

R³ für Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₂)-Alkyl oder (C₁-C₂)-Haloalkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Formyl, (C₁-C₂)-Alkyl, (C₁-C₂)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-
Cycloalkyl, (C₁-C₂)-Alkoxy, (C₁-C₂)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxycarbonyl, (C₁-C₄)-

25

Alkoxythiocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₂)-alkyl, (C₁-C₂)-Alkyl-(C₃-C₆)-cycloalkyl oder
(C₁-C₂)-Alkoxy-(C₁-C₂)-alkyl steht,

X für N oder CR⁵ steht,

30 Y für N oder CH steht,

und

R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder Cyano steht.

35

Weiterer besonders bevorzugter Erfindungsgegenstand sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I),
worin

R¹ für die Gruppen R¹-1 bis R¹-3 steht,

R² unabhängig voneinander für Chlor, Brom, Cyano oder Methyl steht,

5

n ist gleich 1 oder 2,

R³ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro oder Trifluormethyl steht,

10 R⁴ für Wasserstoff, Chlor, Brom, Jod, Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlorfluormethyl, Difluorchlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Difluorbrommethyl, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, (1-Methyl)cyclopropyl oder Methoxymethyl steht,

X für N oder CR⁵ steht,

15

Y für N oder CH steht,

und

20 R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Cyano steht.

Äußerst bevorzugter Erfindungsgegenstand sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

R¹ für die Gruppen R¹-1, R¹-2 und R¹-3 steht,

25

R² für Methyl steht,

n ist gleich 1 oder 2,

30 R³ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder Trifluormethyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Brom, Jod, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlorfluormethyl, Difluorchlormethyl, Cyclopropylmethyl oder (1-Methyl)cyclopropyl steht,

35 X für N, oder CR⁵ steht,

Y für N oder CH steht,

und

R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Cyano steht.

- 5 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der allgemeinen Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.
- 10 Vor allem aus den Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität und/oder besseren Herstellbarkeit sind erfindungsgemäße Verbindungen der genannten allgemeinen Formel (I) oder deren Salze bzw. deren erfindungsgemäße Verwendung von besonderem Interesse, worin einzelne Reste eine der bereits genannten oder im folgenden genannten bevorzugten Bedeutungen haben, oder insbesondere solche, worin eine oder mehrere der bereits genannten oder im Folgenden genannten bevorzugten
- 15 Bedeutungen kombiniert auftreten.

Im Hinblick auf die erfindungsgemäßen Verbindungen werden die vorstehend und weiter unten verwendeten Bezeichnungen erläutert. Diese sind dem Fachmann geläufig und haben insbesondere die im Folgenden erläuterten Bedeutungen:

20

Sofern nicht anders definiert, gilt generell für die Bezeichnung von chemischen Gruppen, dass die Anbindung an das Gerüst bzw. den Rest des Moleküls über das zuletzt genannte Strukturelement der betreffenden chemischen Gruppe erfolgt, d.h. beispielsweise im Falle von (C₁-C₄)-Alkoxy über das Sauerstoffatom, und im Falle von Carboxy-(C₁-C₄)-alkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl jeweils

25 über das C-Atom der Alkylgruppe.

Erfindungsgemäß steht "Alkylsulfonyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettiges oder verzweigtes Alkylsulfonyl, vorzugsweise mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, z.B. (aber nicht beschränkt auf) (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl.

30

Erfindungsgemäß steht "Alkylthio" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettiges oder verzweigtes S-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, wie (C₁-C₄)-Alkylthio, z.B. (aber nicht beschränkt auf) (C₁-C₄)-Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio, 1,1-Dimethylethylthio.

35

„Alkylsulfinyl (Alkyl-S(=O)-)“, soweit nicht an anderer Stelle anders definiert steht erfindungsgemäß für Alkylreste, die über -S(=O)- an das Gerüst gebunden sind, wie (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, z. B. (aber nicht beschränkt auf) (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, 1,1-

5 Dimethylethylsulfinyl.

„Alkoxy“ bedeutet ein über ein Sauerstoffatom gebundenen Alkylrest, z. B. (aber nicht beschränkt auf) (C₁-C₄)-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy, 1,1-Dimethylethoxy.

10

„Alkylcarbonyl“ (Alkyl-C(=O)-), soweit nicht an anderer Stelle anders definiert, steht erfindungsgemäß für Alkylreste, die über -C(=O)- an das Gerüst gebunden sind, wie (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl. Die Anzahl der C-Atome bezieht sich dabei auf den Alkylrest in der Alkylcarbonylgruppe.

15 „Alkoxy carbonyl (Alkyl-O-C(=O)-)“, soweit nicht an anderer Stelle anders definiert: Alkylreste, die über -O-C(=O)- an das Gerüst gebunden sind, wie (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl. Die Anzahl der C-Atome bezieht sich dabei auf den Alkylrest in der Alkoxy carbonylgruppe.

20 „Alkoxythiocarbonyl (Alkyl-O-C(=S)-)“, soweit nicht an anderer Stelle anders definiert: Alkylreste, die über -O-C(=S)- an das Gerüst gebunden sind, wie (C₁-C₄)-Alkoxythiocarbonyl. Die Anzahl der C-Atome bezieht sich dabei auf den Alkylrest in der Alkoxythiocarbonylgruppe.

Die Bezeichnung "Halogen" bedeutet beispielsweise Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Wird die Bezeichnung für einen Rest verwendet, dann bedeutet "Halogen" beispielsweise ein Fluor-, Chlor-,
25 Brom- oder Iodatom.

Erfindungsgemäß bedeutet „Alkyl“ einen geradkettigen oder verzweigten offenkettigen, gesättigten Kohlenwasserstoffrest, der gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert ist und im letzteren Falle als „substituiertes Alkyl“ bezeichnet wird. Bevorzugte Substituenten sind Halogenatome, Alkoxy-,
30 Haloalkoxy-, Cyano-, Alkylthio, Haloalkylthio-, Amino- oder Nitrogruppen, besonders bevorzugt sind Methoxy, Fluoralkyl, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Die Vorsilbe „Bis“ schließt auch die Kombination unterschiedlicher Alkylreste ein, z. B. Methyl(Ethyl) oder Ethyl(Methyl).

35 „Haloalkyl“, „-alkenyl“ und „-alkinyl“ bedeuten durch gleiche oder verschiedene Halogenatome, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl) wie z. B. CH₂CH₂Cl, CH₂CH₂Br, CHClCH₃, CH₂Cl, CH₂F; Dihaloalkyl (= Dihalogenalkyl) wie z.B. CHF₂, CHCl₂; Perhaloalkyl wie z.B. CF₃, CCl₃, CClF₂, CBrF₂, CFCl₂,

CF₂CClF₂, CF₂CClFCF₃; Polyhaloalkyl wie z. B. CH₂CHFCl, CF₂CClFH, CF₂CBrFH, CH₂CF₃; Der Begriff Perhaloalkyl umfasst dabei auch den Begriff Perfluoralkyl.

5 „Haloalkoxy“ ist z.B. OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, OCF₂CF₃, OCH₂CF₃ und OCH₂CH₂Cl; entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierten Reste.

Der hier beispielhaft genannte Ausdruck "(C₁-C₄)-Alkyl" bedeutet eine Kurzschreibweise für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit einem bis 4 Kohlenstoffatomen entsprechend der Bereichsangabe für C-Atome, d. h. umfasst die Reste Methyl, Ethyl, 1-Propyl, 2-Propyl, 1-Butyl, 10 2-Butyl, 2-Methylpropyl oder tert-Butyl.

Wenn nicht speziell angegeben, sind bei den Kohlenwasserstoffresten wie Alkyl-, Alkenyl- und Alkinylresten, auch in zusammengesetzten Resten, die niederen Kohlenstoffgerüste, z.B. mit 1 bis 6 C-Atomen bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 C-Atomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den 15 zusammengesetzten Resten wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkinylreste haben die Bedeutung der Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste, wobei mindestens eine Doppelbindung bzw. Dreifachbindung enthalten ist. Bevorzugt sind Reste mit einer Doppelbindung bzw. 20 Dreifachbindung.

Der Begriff „Alkenyl“ schließt insbesondere auch geradkettige oder verzweigte offenkettige Kohlenwasserstoffreste mit mehr als einer Doppelbindung ein, wie 1,3-Butadienyl und 1,4-Pentadienyl, aber auch Allenyl- oder Kumulenyl-reste mit einer bzw. mehreren kumulierten Doppelbindungen, wie 25 beispielsweise Allenyl (1,2-Propadienyl) und 1,2-Butadienyl. Alkenyl bedeutet z.B. Vinyl, welches ggf. durch weitere Alkylreste substituiert sein kann, z. B. (aber nicht beschränkt auf) (C₂-C₄)-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl.

30 Der Begriff „Alkinyl“ schließt insbesondere auch geradkettige oder verzweigte offenkettige Kohlenwasserstoffreste mit mehr als einer Dreifachbindung oder auch mit einer oder mehreren Dreifachbindungen und einer oder mehreren Doppelbindungen ein, wie beispielsweise 1,3-Butatrienyl. (C₂-C₄)-Alkinyl bedeutet z.B. Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl.

35 Der Begriff „Cycloalkyl“ bedeutet ein carbocyclisches, gesättigtes Ringsystem mit vorzugsweise 3-6 Ring-C-Atomen, z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, das gegebenenfalls weiter

substituiert ist, bevorzugt durch Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano, Nitro, Alkylthio, Haloalkylthio, Halogen, Alkenyl, Alkynyl, Haloalkyl, Amino, Alkylamino, Bisalkylamino, Alkocycarbonyl, Hydroxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Cycloalkylaminocarbonyl. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Cycloalkyl werden cyclische Systeme mit Substituenten umfasst, wobei auch Substituenten mit einer Doppelbindung am Cycloalkylrest, z. B. eine Alkylidengruppe wie Methyliden, umfasst sind. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Cycloalkyl werden auch mehrcyclische aliphatische Systeme umfasst, wie beispielsweise Bicyclo[1.1.0]butan-1-yl, Bicyclo[1.1.0]butan-2-yl, Bicyclo[2.1.0]pentan-1-yl, Bicyclo[1.1.1]pentan-1-yl, Bicyclo[2.1.0]pentan-2-yl, Bicyclo[2.1.0]pentan-5-yl und Bicyclo[2.1.1]hexyl, aber auch Systeme wie z. B. 1,1'-Bi(cyclopropyl)-1-yl, 1,1'-Bi(cyclopropyl)-2-yl. Der Ausdruck "(C₃-C₆)-Cycloalkyl" bedeutet eine Kurzschreibweise für Cycloalkyl mit drei bis 6 Kohlenstoffatomen entsprechend der Bereichsangabe für C-Atome.

Im Falle von substituiertem Cycloalkyl werden auch spirocyclische aliphatische Systeme umfasst, wie beispielsweise Spiro[2.2]pent-1-yl, Spiro[2.3]hex-1-yl, Spiro[2.3]hex-4-yl, 3-Spiro[2.3]hex-5-yl.

Erfindungsgemäß steht "Haloalkylthio" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettiges oder verzweigtes S-Halogenalkyl, vorzugsweise mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, wie (C₁-C₄)-Haloalkylthio, z.B. (aber nicht beschränkt auf) Trifluormethylthio, Pentafluorethylthio, Difluormethyl, 2,2-Difluoreth-1-ylthio, 2,2,2-Difluoreth-1-ylthio, 3,3,3-prop-1-ylthio.

„Halocycloalkyl“ bedeutet durch gleiche oder verschiedene Halogenatome, wie z. B. F, Cl und Br, oder durch Haloalkyl, wie z. B. Trifluormethyl oder Difluormethyl teilweise oder vollständig substituiertes Cycloalkyl, z.B. 1-Fluorcycloprop-1-yl, 2-Fluorcycloprop-1-yl, 2,2-Difluorcycloprop-1-yl, 1-Fluorcyclobut-1-yl, 1-Trifluormethylcycloprop-1-yl, 2-Trifluormethylcycloprop-1-yl, 1-Chlorcycloprop-1-yl, 2-Chlorcycloprop-1-yl, 2,2-Dichlorcycloprop-1-yl, 3,3-Difluorcyclobutyl.

Erfindungsgemäß steht "Trialkylsilyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettiges oder verzweigtes Si-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie Tri-(C₁-C₂)-alkyl]silyl, z.B. (aber nicht beschränkt auf) Trimethylsilyl, Triethylsilyl.

Steht ein Sammelbegriff für einen Substituenten, z. B. (C₁-C₄)-Alkyl, am Ende eines zusammengesetzten Substituenten wie z.B. bei (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, so kann der am Anfang stehende Bestandteil des zusammengesetzten Substituenten, z.B. das (C₃-C₆)-Cycloalkyl, ein- bzw. mehrfach, gleich oder verschieden und unabhängig voneinander mit dem letzten Substituenten, im vorliegenden Beispiel (C₁-C₄)-Alkyl, substituiert sein.

Die Definition für Sammelbegriffe solange nicht anders definiert gilt auch für diese Sammelbegriffe in zusammengesetzten Substituenten. Beispiel: Die Definition für (C₁-C₄)-Alkyl gilt auch für (C₁-C₄)-Alkyl als Bestandteil eines zusammengesetzten Substituenten wie z.B. (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl.

5

Wenn die Verbindungen durch Wasserstoffverschiebung Tautomere bilden können, welche strukturell formal nicht durch die allgemeine Formel (I) erfasst würden, so sind diese Tautomere gleichwohl von der Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) umfasst, sofern nicht ein bestimmtes Tautomer Gegenstand der Betrachtung ist. So können beispielsweise viele

10 Carbonylverbindungen sowohl in der Ketoform wie auch in der Enolform vorliegen, wobei beide Formen durch die Definition der Verbindung der allgemeinen Formel (I) umfasst werden.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können je nach Art und Verknüpfung der Substituenten als Stereoisomere vorliegen. Die durch ihre spezifische Raumform definierten möglichen Stereoisomere, wie Enantiomere, Diastereomere, Z- und E-Isomere sind alle von der allgemeinen Formel (I) umfasst.

15

Sind beispielsweise eine oder mehrere Alkenylgruppen vorhanden, so können Diastereomere (Z- und E-Isomere) auftreten. Sind beispielsweise ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome vorhanden, so können Enantiomere und Diastereomere auftreten. Stereoisomere lassen sich aus den bei der Herstellung anfallenden Gemischen nach üblichen Trennmethode erhalten. Die chromatographische Trennung kann sowohl im analytischen Maßstab zur Feststellung des Enantiomerenüberschusses bzw. des Diastereomerenüberschusses, wie auch im präparativen Maßstab zur Herstellung von Prüfmustern für die biologische Ausprüfung erfolgen. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft somit auch alle Stereoisomeren, die von der allgemeinen Formel (I) umfasst, jedoch nicht mit ihrer spezifischen Stereoform angegeben sind, sowie deren Gemische.

20

25

Sofern die Verbindungen als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen. Sofern einzelne Verbindungen (I) nicht auf den nachstehend beschriebenen Wegen zufriedenstellend zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen (I) hergestellt werden.

30

Als Isolierungs-, Reinigungs- und Stereoisomerenauffrennungsverfahren von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) kommen Methoden in Frage, die dem Fachmann aus analogen Fällen allgemein bekannt sind, z.B. durch physikalische Verfahren wie Kristallisation, Chromatographieverfahren, vor allem Säulenchromatographie und HPLC (Hochdruckflüssigchromatographie), Destillation, gegebenenfalls unter reduziertem Druck, Extraktion und andere Verfahren, können gegebenenfalls verbleibende Gemische in der Regel durch chromatographische Trennung, z.B. an chiralen Festphasen,

35

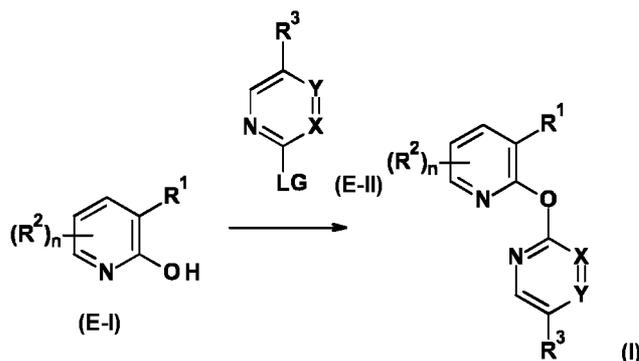
getrennt werden. Für präparative Mengen oder im industriellen Maßstab kommen Verfahren in Frage wie Kristallisation, z.B. diastereomerer Salze, die aus den Diastereomerenmischungen mit optisch aktiven Säuren und gegebenenfalls bei vorhandenen sauren Gruppen mit optisch aktiven Basen erhalten werden können.

5

Die vorliegende Erfindung beansprucht auch Verfahren zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I).

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können unter anderem ausgehend von bekannten Verfahren hergestellt werden. Die eingesetzten und untersuchten Syntheserouten gehen dabei von kommerziell erhältlichen oder leicht herstellbaren Bausteinen aus. Die Gruppierungen R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und n der allgemeinen Formel (I) haben in den nachfolgenden Schemata die zuvor definierten Bedeutungen, sofern nicht beispielhafte, aber nicht einschränkende, Definitionen erfolgen.

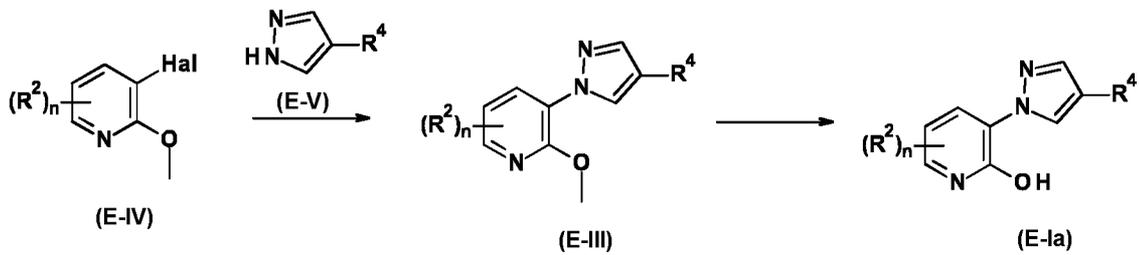
15 Erfindungsgemäße Verbindungen können beispielsweise nach der in Schema 1 angegebenen Methode hergestellt werden.



Schema 1.

20 Die Heteroaryloxypyridine der allgemeinen Formel (I) können über eine Alkylierung der Hydroxypyridine (E-I) in Gegenwart von Basen mit dem Pyridin, Pyrimidin oder Pyrazin (E-II), wobei LG eine Abgangsgruppe ist, hergestellt werden. Die Base kann ein Carbonat-Salz von einem Alkali-Metall (wie zum Beispiel Natrium, Kalium oder Cäsium), oder Silbercarbonat sein. Die Reaktionen werden im Allgemeinen in einem organischen Lösungsmittel, wie zum Beispiel Acetonitril, Butyronitril, Dimethylformamid, oder 1-Methyl-2-pyrrolidon, bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösemittels, durchgeführt. Die in Schema 1 genannten Reste R^1 , R^2 , R^3 , X und Y sowie der Index n entsprechen den zuvor genannten Definitionen.

25

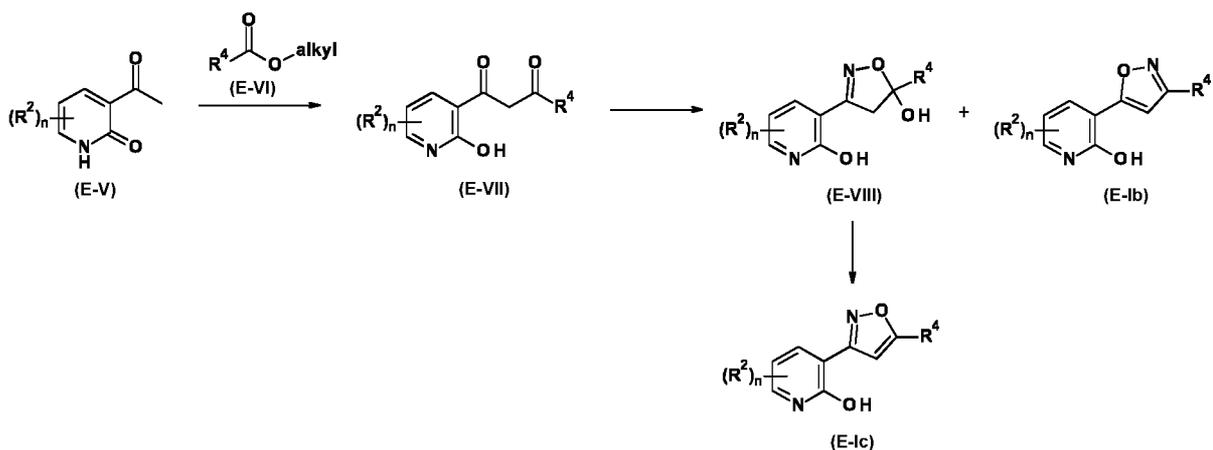


Schema 2.

Die Pyridine der allgemeinen Formel (E-Ia) können über eine Demethylierung der Pyridine (E-III) in
 5 Gegenwart von entweder Bromwasserstoffsäure und Essigsäure oder Bortribromid hergestellt werden (Schema 2). Die Reaktionen mit Bortribromid werden im Allgemeinen in einem organischen Lösungsmittel, wie zum Beispiel Dichlormethan, bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösemittels, durchgeführt.

Die Pyridine der allgemeinen Formel (E-III) können über eine Kopplung der Pyridine (E-IV) mit dem
 10 Pyrazol (E-V) in Gegenwart von Katalysatoren, Liganden und Basen, wobei Hal ein Halogen wie Jod oder Brom ist, hergestellt werden. Der Katalysator kann ein Kupfersalz (wie zum Beispiel CuI) sein. Der Ligand kann ein Amin (wie zum Beispiel *N,N'*-Dimethylethan-1,2-diamin oder *N,N*-Dimethylglycin) sein. Die Base kann ein Carbonat-Salz von einem Alkali-Metall (wie zum Beispiel Natrium, Kalium
 15 oder Cäsium) sein. Die Reaktionen werden im Allgemeinen in einem organischen Lösungsmittel, wie zum Beispiel 1,4-Dioxan, Dimethylformamid, oder Dimethylacetamid, bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösemittels, durchgeführt.

Die Synthese der Pyridine (E-IV) ist dem Fachmann bekannt und beispielsweise in WO2011/48525 und
 20 US2013/143907 beschrieben. Die in Schema 2 genannten Reste R^2 und R^4 , sowie der Index n entsprechen den zuvor genannten Definitionen.



Schema 3

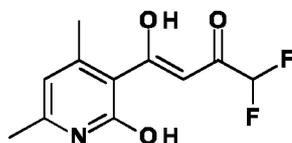
- Die Pyridine der allgemeinen Formel (E-Ic) können über eine Dehydrierung der Pyridine (E-VIII) unter saure oder basische Bedingungen, hergestellt werden. Die Reaktionen unter saure Bedingungen werden in Gegenwart mit Säuren (wie zum Beispiel Salzsäure und Essigsäure) durchgeführt. Die Reaktionen unter basische Bedingungen werden in Gegenwart von Basen (wie zum Beispiel ein Carbonat-Salz von einem Alkali-Metall) und einem organischen Lösungsmittel (wie zum Beispiel Acetonitril oder Dimethylformamid), bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösemittels, durchgeführt.
- 10 Die Pyridine der allgemeinen Formel (E-Ib) und (E-VIII) können über eine Reaktion der Diketone (E-VII) mit Hydroxylamin oder Hydroxylamin-Hydrochlorid hergestellt werden. Reaktionen werden im Allgemeinen in einem organischen Lösungsmittel, wie zum Beispiel Methanol oder Ethanol, bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösemittels, durchgeführt.
- 15 Die Diketone der allgemeinen Formel (E-VII) können über eine Reaktion der Ketone (E-V) mit Estern (E-VI), in Gegenwart von Basen hergestellt werden. Die Base kann ein Natrium-Salz von einem Alkohol (wie zum Beispiel Methanol oder Ethanol) sein. Reaktionen werden im Allgemeinen in einem organischen Lösungsmittel, wie zum Beispiel Tetrahydrofuran, Methanol oder Ethanol, bei Temperaturen zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Lösemittels, durchgeführt.
- 20 Die Synthese der Ketone (E-V) ist dem Fachmann bekannt und beispielsweise in J. Org. Chem. 1970, 35, 3596-3600 und Chem. Pharm. Bull. 1976, 24, 303-309 beschrieben. Die in Schema 3 genannten Reste R² und R⁴, sowie der Index n entsprechen den zuvor genannten Definitionen.

25

Synthesebeispiele

Synthesebeispiel Nr. I-8:

- 30 Synthesestufe 1: (Z)-1,1-Difluor-4-hydroxy-4-(2-hydroxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl)but-3-en-2-on (Intermediat A-01)

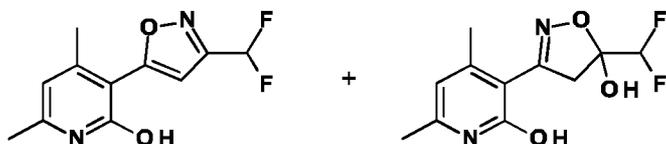


Eine Mischung von 3-Acetyl-4,6-dimethylpyridin-2(1H)-on (11.40 g, 69.0 mmol), Ethyl 2,2-difluoracetate (10.16 ml, 96.6 mmol) und Natriummethoxid (30% Lösung in Methanol, 37.3 g, 207.0 mmol) in 80 ml Tetrahydrofuran wurde bei 60 °C für 4 h erhitzt. Das resultierende Reaktionsgemisch

wurde auf Raumtemperatur abgekühlt, eingengt, mit Wasser (25 ml) verdünnt und anschließend mit 2M Salzsäure auf pH 6-7 gebracht. Durch anschließende Filtration konnte (Z)-1,1-Difluor-4-hydroxy-4-(2-hydroxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl)but-3-en-2-on isoliert werden. Die Ausbeute betrug 7.10 g (42% der Theorie).

5

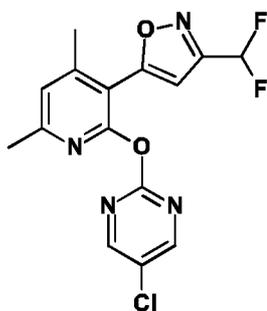
Synthesestufe 2: 4,6-Dimethyl-3-[3-(difluormethyl)isoxazol-5-yl]pyridin-2-ol (Intermediat A-02) und 3-(2-hydroxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl)-5-(difluormethyl)-4H-isoxazol-5-ol (Intermediat A-03)



Eine Mischung von (Z)-1,1-Difluor-4-hydroxy-4-(2-hydroxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl)but-3-en-2-on (Intermediat A-01, 1.50 g, 6.17 mmol) and Hydroxylaminhydrochlorid (860 mg, 12.3 mmol) in 10 ml Ethanol wurde bei 90 °C für 3 h erhitzt. Das resultierende Reaktionsgemisch wurde auf Raumtemperatur abgekühlt. Durch anschließend Filtration konnte 4,6-Dimethyl-3-[3-(difluormethyl)isoxazol-5-yl]pyridin-2-ol isoliert werden. Die Ausbeute betrug 1.07 g (72% der Theorie).

Das Filtrat wurde eingengt. Durch abschließende säulenchromatographische Reinigung (Gradient Essigester/Heptan) des resultierenden Rohproduktes konnte 3-(2-Hydroxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl)-5-(difluormethyl)-4H-isoxazol-5-ol isoliert werden. Die Ausbeute betrug 180 mg (11% der Theorie).

Synthesestufe 3: 5-[2-(5-Chlorpyrimidin-2-yl)oxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl]-3-(difluormethyl)isoxazol (Synthesebeispiel Nr. I-1)



20

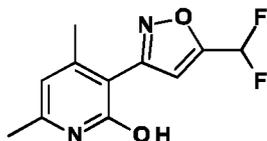
Eine Mischung von 4,6-Dimethyl-3-[3-(difluormethyl)isoxazol-5-yl]pyridin-2-ol (Intermediat A-02, 150 mg, 0.59 mmol), 2-Brom-5-chlorpyrimidin (120 mg, 0.52 mmol) and Cesiumcarbonat (290 mg, 0.89 mmol) in 10 ml Dimethylacetamid wurde in der Mikrowelle bei 100 °C für 60 Minuten erhitzt. Das resultierende Reaktionsgemisch wurde auf Raumtemperatur abgekühlt, mit Wasser verdünnt und anschließend mehrmals mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden danach mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und eingengt. Durch anschließende säulenchromatographische Reinigung (Gradient Essigester/Heptan) des resultierenden Rohproduktes konnte 5-[2-(5-Chlorpyrimidin-2-yl)oxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl]-3-

25

(difluormethyl)isoxazol (Synthesebeispiel Nr. I-1) isoliert werden. Die Ausbeute betrug 64 mg (31% der Theorie).

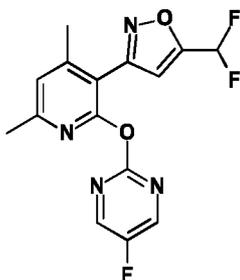
Synthesebeispiel Nr. I-15:

5 Synthesestufe 1: 3-[5-(Difluormethyl)isoxazol-3-yl]-4,6-dimethyl-pyridin-2-ol (Intermediat A-04)



10 Eine Mischung von 3-(2-Hydroxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl)-5-(difluormethyl)-4H-isoxazol-5-ol (Intermediat A-03, 800 mg, 2.79 mmol), Essigsäure (1.9 ml) und konzentrierte Salzsäure (0.7 ml) wurde bei 80 °C für 24 h erhitzt. Das resultierende Reaktionsgemisch wurde auf Raumtemperatur abgekühlt und mit 50 ml Wasser verdünnt. Durch anschließende Filtration konnte 3-[5-(Difluormethyl)isoxazol-3-yl]-4,6-dimethyl-pyridin-2-ol isoliert werden. Die Ausbeute betrug 690 mg (98% der Theorie).

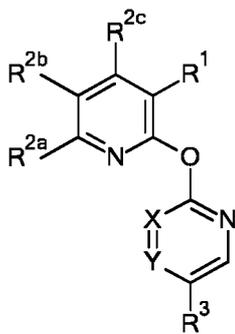
Synthesestufe 2: 5-(Difluormethyl)-3-[2-(5-fluorpyrimidin-2-yl)oxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl]isoxazol (Synthesebeispiel Nr. I-3)



15 Eine Mischung von 3-[5-(Difluormethyl)isoxazol-3-yl]-4,6-dimethyl-pyridin-2-ol (Intermediat A-04, 690 mg, 2.73 mmol), 2-Chlor-5-fluorpyrimidin (435 mg, 3.28 mmol) und Cesiumcarbonat (1.78 g, 5.46 mmol) in 8 ml Dimethylformamid wurde bei 80 °C für 5 h erhitzt. Das resultierende Reaktionsgemisch wurde auf Raumtemperatur abgekühlt, mit Wasser verdünnt und anschließend mehrmals mit
20 Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden danach mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Durch abschließende säulenchromatographische Reinigung (Gradient Essigester/Heptan) des resultierenden Rohproduktes konnte 5-(Difluormethyl)-3-[2-(5-fluorpyrimidin-2-yl)oxy-4,6-dimethyl-3-pyridyl]isoxazol (Synthesebeispiel Nr. I-3) isoliert werden. Die Ausbeute betrug 67 mg (7% der Theorie).

25

In Analogie zu den oben angeführten und an entsprechender Stelle rezierten Herstellungsbeispielen erhält man die nachfolgend genannten und in Tabelle 1 dargestellten Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



(I)

Tabelle 1

Beispielnummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-1	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-2	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-3	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-4	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-5	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-6	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-7	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-8	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-9	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	H	F	N	CH
I-10	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-11	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	N
I-12	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	H	Cl	N	CH
I-13	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	H	F	N	CH
I-14	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-15	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-16	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-17	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-18	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	N
I-19	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-20	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	CH
I-21	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-22	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-23	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-24	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-25	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-26	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-27	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-28	3-CF ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-29	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-30	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	N
I-31	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-32	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	CH

Beispielnummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-33	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-34	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-35	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-36	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-37	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-38	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-39	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-40	5-CF ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-41	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-42	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	N
I-43	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	CH
I-44	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	NO ₂	N	CH
I-45	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	CF ₃	N	CH
I-46	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	CN	N	CH
I-47	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-48	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-49	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-50	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-51	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-52	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-53	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-54	3-CHF ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-55	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-56	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	N
I-57	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-58	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	CH
I-59	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-60	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-61	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-62	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-63	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-64	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-65	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-66	5-CHF ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-67	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-68	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-69	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-70	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-71	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-72	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-73	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-74	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-75	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-76	3-CHFCl-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-77	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH

Beispiel- nummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-78	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-79	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-80	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-81	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-82	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-83	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-84	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-85	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-86	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-87	5-CHFCl-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-88	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-89	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-90	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-91	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	CH
I-92	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CH	N
I-93	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-94	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-95	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-96	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-97	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-98	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-99	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-100	3-CF ₂ Cl-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-101	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-102	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-103	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-104	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-105	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-106	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-107	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-108	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-109	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-110	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-111	5-CF ₂ Cl-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-112	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-113	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-114	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-115	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-116	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-117	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-118	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-119	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-120	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-121	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-122	3-CCl ₃ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH

Beispielnummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-123	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-124	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-125	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-126	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-127	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-128	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-129	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-130	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-131	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-132	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-133	5-CCl ₃ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-134	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-135	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-136	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-137	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-138	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-139	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-140	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-141	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-142	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-143	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-144	3-CHCl ₂ -5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-145	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-146	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-147	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-148	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-149	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-150	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-151	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-152	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-153	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-154	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-155	5-CHCl ₂ -3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-156	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-157	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-158	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-159	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-160	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-161	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-162	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-163	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-164	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-165	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-166	3-CF ₂ Br-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-167	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH

Beispielnummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-168	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-169	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-170	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-171	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-172	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-173	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-174	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-175	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-176	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-177	5-CF ₂ Br-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-178	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-179	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-180	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-181	3-cPr-5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-182	3-cPr-5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-183	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-184	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-185	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-186	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-187	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-188	3-cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-189	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-190	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-191	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-192	5-cPr-3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-193	5-cPr-3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-194	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-195	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-196	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-197	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-198	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-199	5-cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-200	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-201	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-202	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-203	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-204	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-205	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-206	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-207	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-208	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-209	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-210	3-CH ₂ cPr-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-211	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-212	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH

Beispiel- nummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-213	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-214	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-215	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-216	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-217	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-218	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-219	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-220	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-221	5-CH ₂ cPr-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-222	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-223	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-224	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-225	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-226	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-227	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-228	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-229	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-230	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-231	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-232	3-CH ₂ OMe-5-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-233	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-234	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-235	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-236	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-237	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-238	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-239	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-240	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-241	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-242	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-243	5-CH ₂ OMe-3-Isoxazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-244	1-Pyrazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-245	1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-246	1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-247	1-Pyrazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-248	1-Pyrazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-249	1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-250	1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-251	1-Pyrazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-252	1-Pyrazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-253	1-Pyrazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-254	1-Pyrazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-255	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-256	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-257	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH

Beispielnummer	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ³	X	Y
I-258	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-259	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-260	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-261	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-262	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-263	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-264	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-265	4-CF ₃ -1-Pyrazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-266	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-267	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-268	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-269	4-Cl-1-Pyrazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-270	4-Cl-1-Pyrazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-271	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-272	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-273	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-274	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-275	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-276	4-Cl-1-Pyrazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-277	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-278	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-279	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH
I-280	4-Br-1-Pyrazolyl	H	H	Me	F	N	CH
I-281	4-Br-1-Pyrazolyl	H	H	Me	Cl	N	CH
I-282	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	F	N	CH
I-283	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Cl	Cl	N	CH
I-284	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Br	F	N	CH
I-285	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	Br	Cl	N	CH
I-286	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	CN	F	N	CH
I-287	4-Br-1-Pyrazolyl	Me	H	CN	Cl	N	CH
I-288	3-CHF ₂ -5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Cl	CCl	CH
I-289	3-CHF ₂ -5-Isloxazolyl	Me	H	Me	F	CCN	CH
I-290	3-CHF ₂ -5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Cl	CCN	CH
I-291	3-CHF ₂ -5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Br	CCN	CH
I-292	3-CHF ₂ -5-Isloxazolyl	Me	H	Me	CN	CH	CH
I-293	3-CHF ₂ -5-Isloxazolyl	Me	H	Me	F	CH	CH
I-294	4-I-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-295	4-I-1-Pyrazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-296	3-cPr-5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-297	3-(1-Methylcyclopropyl)-5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Cl	N	CH
I-298	3-(1-Methylcyclopropyl)-5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-299	3-(1-Methylcyclopropyl)-5-Isloxazolyl	Me	H	Me	F	N	CH
I-300	3-CH ₂ cPr-5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Br	N	CH
I-301	3-(1-Methylcyclopropyl)-5-Isloxazolyl	Me	H	Me	Cl	CF	CH

NMR-Daten ausgewählter Beispiele

Ausgewählte detaillierte Synthesebeispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formeln (I) sind im Folgenden aufgeführt. Die ¹H-NMR-spektroskopischen Daten, die für die in den nachfolgenden Abschnitten beschriebenen chemischen Beispiele angegeben sind, (400 MHz bei ¹H-NMR, Lösungsmittel CDCl₃ oder d₆-DMSO, interner Standard: Tetramethylsilan δ = 0.00 ppm), wurden mit einem Gerät der Firma Bruker erhalten, und die bezeichneten Signale haben die nachfolgend aufgeführten Bedeutungen: br = breit(es); s = Singulett, d = Dublett, t = Triplett, dd = Doppeldublett, ddd = Dublett eines Doppeldubletts, m = Multiplett, q = Quartett, quint = Quintett, sext = Sextett, sept = Septett, dq = Doppelquartett, dt = Doppeltriplett. Bei Diastereomergemischen werden entweder die jeweils signifikanten Signale beider Diastereomere oder das charakteristische Signal des Hauptdiastereomers angegeben.

15 Beispiel Nr. I-1:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.51 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.76 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.48 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-2:

20 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.53 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 2.50 (s, 3H), 2.48 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-3:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.42 (s, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.64 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.52 (s, 3H).

25

Beispiel Nr. I-4:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.44 (s, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.76 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 2.48 (s, 3H), 2.47 (s, 3H).

30 Beispiel Nr. I-5:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.51 (s, 2H), 7.13 (d, *J* = 50 Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.47 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-6:

35 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.43 (s, 2H), 7.51 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.52 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-7:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.50 (s, 2H), 7.51 (s, 1H), 7.11 (s, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.53 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-8:

5 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.52 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 2.50 (s, 3H), 2.49 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-10:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.49 (s, 2H), 7.39 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.63 (t, *J* = 55Hz, 1H), 2.53 (s, 3H), 2.52 (s, 3H).

10

Beispiel Nr. I-11:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.29 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.81 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.77 (s, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.42 (s, 3H).

15 Beispiel Nr. I-12:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.58 (s, 2H), 8.30 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.63 (t, *J* = 50 Hz, 1H), 2.52 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-13:

20 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.52 (s, 2H), 8.30 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.78 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 2.50 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-14:

25 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.09 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.81 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 2.48 (s, 3H), 2.37 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-41:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.59 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.76 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.47 (s, 3H).

30

Beispiel Nr. I-43:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.19 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.00-6.97 (m, 2H), 6.78 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.72 (s, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H).

35

Beispiel Nr. I-45:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.79 (s, 2H), 7.13 (s, 1H), 6.75 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.71 (s, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.49 (s, 3H).

5 Beispiel Nr. I-46:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.81 (s, 2H), 7.15 (s, 1H), 6.75 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 2.53 (s, 3H), 2.48 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-178:

10 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.41 (s, 2H), 7.03 (s, 1H), 6.20 (s, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 1.99-1.95 (m, 1H), 1.04-0.99 (m, 2H), 0.82-0.78 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-179:

15 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.47 (s, 2H), 7.04 (s, 1H), 6.18 (s, 1H), 2.48 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 1.99-1.95 (m, 1H), 1.04-0.99 (m, 2H), 0.82-0.78 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-180:

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO δ, ppm) 8.27 (dd, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.17 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.07-2.01 (m, 1H), 1.05-1.00 (m, 2H), 0.82-0.78 (m, 2H).

20

Beispiel Nr. I-200:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.40 (s, 2H), 7.04 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 2.56 (d, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 1.01-0.93 (m, 1H), 0.56-0.51 (m, 2H), 0.22-0.18 (m, 2H).

25 Beispiel Nr. I-201:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.47 (s, 2H), 7.06 (s, 1H), 6.44 (s, 1H), 2.56 (d, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 1.01-0.93 (m, 1H), 0.56-0.51 (m, 2H), 0.21-0.17 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-202:

30 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.04 (d, 1H), 7.52 (dd, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 2.61 (d, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.05-1.01 (m, 1H), 0.59-0.54 (m, 2H), 0.26-0.22 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-244:

35 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.35 (s, 2H), 7.62 (dd, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.32 (dd, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.19 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-245:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.42 (s, 2H), 7.62 (dd, 1H), 7.54 (dd, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.32 (dd, 1H), 2.53 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

5 Beispiel Nr. I-277:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.39 (s, 2H), 7.59 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 2.50 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-278:

10 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.46 (s, 2H), 7.59-7.57 (m, 2H), 7.08 (s, 1H), 2.51 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-288:

15 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.11 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 6.97 (s, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.79 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-289:

20 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.30 (d, 1H), 7.78 (dd, 1H), 7.03 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.80 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.43 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-290:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.35 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.79 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.77 (s, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.46 (s, 3H).

25 Beispiel Nr. I-291:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.44 (d, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.79 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.77 (s, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.46 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-292:

30 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.48 (dd, 1H), 7.96 (dd, 1H), 7.11 (dd, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.76 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.63 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.46 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-293:

35 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.10 (d, 1H), 7.50-7.45 (m, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.78 (t, *J* = 55 Hz, 1H), 6.76 (s, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.42 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-294:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.38 (s, 2H), 7.63-7.61 (m, 2H), 7.06 (s, 1H), 2.50 (s, 3H), 2.19 (s, 3H).

5 Beispiel Nr. I-295:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.46 (s, 2H), 7.63 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 2.51 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

Beispiel Nr. I-296:

10 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.55 (s, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.18 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 1.99-1.95 (m, 1H), 1.04-0.99 (m, 2H), 0.82-0.78 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-297:

15 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.46 (s, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.18 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 0.98-0.95 (m, 2H), 0.84-0.81 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-298:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.55 (s, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.18 (s, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 0.98-0.95 (m, 2H), 0.85-0.81 (m, 2H).

20

Beispiel Nr. I-299:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.41 (s, 2H), 7.03 (s, 1H), 6.20 (s, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 1.45 (s, 3H), 0.99-0.96 (m, 2H), 0.84-0.81 (m, 2H).

25 Beispiel Nr. I-300:

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.55 (s, 2H), 7.06 (s, 1H), 6.43 (s, 1H), 2.56 (d, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 1.01-0.93 (m, 1H), 0.56-0.51 (m, 2H), 0.21-0.17 (m, 2H).

Beispiel Nr. I-301:

30 ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.05 (d, 1H), 7.53 (dd, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.26 (s, 1H), 2.45 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.49 (s, 3H), 1.05-1.02 (m, 2H), 0.86-0.83 (m, 2H).

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung einer oder mehrerer

Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salzen, wie oben definiert, vorzugsweise in

35 einer der als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt gekennzeichneten Ausgestaltung, insbesondere einer oder mehrerer Verbindungen der Formeln (1-1) bis (1-301) und/oder deren Salze, jeweils wie oben

definiert, als Herbizid und/oder Pflanzenwachstumsregulator, vorzugsweise in Kulturen von Nutz- und/oder Zierpflanzen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ferner ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen und/oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass eine wirksame Menge

- einer oder mehrerer Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salzen, wie oben definiert, vorzugsweise in einer der als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt gekennzeichneten Ausgestaltung, insbesondere einer oder mehrerer Verbindungen der Formeln (1-1) bis (1-301) und/oder deren Salze, jeweils wie oben definiert, oder

- eines erfindungsgemäßen Mittels, wie nachstehend definiert, auf die (Schad)Pflanzen, (Schad)Pflanzensamen, den Boden, in dem oder auf dem die (Schad)Pflanzen wachsen, oder die Anbaufläche appliziert wird.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist auch ein Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen, vorzugsweise in Nutzpflanzenkulturen, dadurch gekennzeichnet, dass eine wirksame Menge

- einer oder mehrerer Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salzen, wie oben definiert, vorzugsweise in einer der als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt gekennzeichneten Ausgestaltung, insbesondere einer oder mehrerer Verbindungen der Formeln (1-1) bis (1-301) und/oder deren Salze, jeweils wie oben definiert, oder

- eines erfindungsgemäßen Mittels, wie nachstehend definiert, auf unerwünschte Pflanzen (z.B. Schadpflanzen wie mono- oder dikotyle Unkräuter oder unerwünschte Kulturpflanzen), das Saatgut der unerwünschten Pflanzen (d.h. Pflanzensamen, z.B. Körner, Samen oder vegetative Vermehrungsorgane wie Knollen oder Sprosstteile mit Knospen), den Boden, in dem oder auf dem die unerwünschte Pflanzen wachsen, (z.B. den Boden von Kulturland oder Nicht-Kulturland) oder die Anbaufläche (d.h. Fläche, auf der die unerwünschte Pflanzen wachsen werden) appliziert wird.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ferner auch ein Verfahren zur Bekämpfung zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, vorzugsweise von Nutzpflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass eine wirksame Menge

- einer oder mehrerer Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salzen, wie oben definiert, vorzugsweise in einer der als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt gekennzeichneten

Ausgestaltung, insbesondere einer oder mehrerer Verbindungen der Formeln (1-1) bis (1-301) und/oder deren Salze, jeweils wie oben definiert, oder

- eines erfindungsgemäßen Mittels, wie nachstehend definiert,
- 5 die Pflanze, das Saatgut der Pflanze (d.h. Pflanzensamen, z.B. Körner, Samen oder vegetative Vermehrungsorgane wie Knollen oder Sprosssteile mit Knospen), den Boden, in dem oder auf dem die Pflanzen wachsen, (z.B. den Boden von Kulturland oder Nicht-Kulturland) oder die Anbaufläche (d.h. Fläche, auf der die Pflanzen wachsen werden) appliziert wird.
- 10 Dabei können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. die erfindungsgemäßen Mittel z.B. im Vorsaats- (gegebenenfalls auch durch Einarbeitung in den Boden), Vorauf- und/oder Nachaufverfahren ausgebracht werden. Im Einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne dass durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.
- 15 Vorzugsweise werden in einem erfindungsgemäßen Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen eine oder mehrere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze zur Bekämpfung von Schädlingen oder zur Wachstumsregulierung in Kulturen von Nutzpflanzen oder Zierpflanzen eingesetzt, wobei die Nutzpflanzen oder Zierpflanzen in einer
- 20 bevorzugten Ausgestaltung transgene Pflanzen sind.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze eignen sich zur Bekämpfung der folgenden Gattungen von monokotylen und dikotylen Schädlingen:

Monokotyle Schädlinge der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, 25 Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Dikotyle Schädlinge der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, 30 Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, 35 Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vor dem Keimen der Schadpflanzen (Ungräser und/oder Unkräuter) auf die Erdoberfläche appliziert (Vorauflaufverfahren), so wird entweder das Auflaufen der Ungras- bzw. Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder diese wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe der allgemeinen Formel (I) auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt nach der Behandlung Wachstumsstop ein und die Schadpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so dass auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen z.B. dikotyler Kulturen der Gattungen Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Miscanthus, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia, oder monokotyle Kulturen der Gattungen Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, abhängig von der Struktur der jeweiligen erfindungsgemäßen Verbindung und deren Aufwandmenge nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in Pflanzenkulturen wie landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen oder Zierpflanzungen.

Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) (abhängig von ihrer jeweiligen Struktur und der ausgebrachten Aufwandmenge) hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung, wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativem Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da beispielsweise die Lagerbildung hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften können die Wirkstoffe der allgemeinen Formel (I) auch zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von gentechnisch oder durch konventionelle Mutagenese veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch

Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z.B. das

5 So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.

Bevorzugt bezüglich transgener Kulturen ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von

10 Nutz und Zierpflanzen, z.B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.

Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auch als

15 Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auch zur Bekämpfung von Schadpflanzen

20 in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere

25 Eigenschaften betreffen z.B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt. Weitere besondere Eigenschaften können in einer Toleranz oder Resistenz gegen abiotische Stressoren z.B. Hitze, Kälte, Trockenheit, Salz und ultraviolette Strahlung liegen.

30

Bevorzugt ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z.B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Triticale, Hirse, Reis, Maniok und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.

35

Vorzugsweise können die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

- 5 Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher vorkommenden Pflanzen modifizierte Eigenschaften aufweisen, bestehen beispielsweise in klassischen Züchtungsverfahren und der Erzeugung von Mutanten. Alternativ können neue Pflanzen mit veränderten Eigenschaften mit Hilfe gentechnischer Verfahren erzeugt werden.
- 10 Zahlreiche molekularbiologische Techniken, mit denen neue transgene Pflanzen mit veränderten Eigenschaften hergestellt werden können, sind dem Fachmann bekannt. Für derartige gentechnische Manipulationen können Nucleinsäuremoleküle in Plasmide eingebracht werden, die eine Mutagenese oder eine Sequenzveränderung durch Rekombination von DNA-Sequenzen erlauben. Mit Hilfe von Standardverfahren können z.B. Basenaustausche vorgenommen, Teilsequenzen entfernt oder natürliche
- 15 oder synthetische Sequenzen hinzugefügt werden. Für die Verbindung der DNA-Fragmente untereinander können an die Fragmente Adaptoren oder Linker angesetzt werden.

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA,

20 einer sense-RNA zur Erzielung eines Cosuppressionseffektes oder die Expression mindestens eines entsprechend konstruierten Ribozyms, das spezifisch Transkripte des obengenannten Genprodukts spaltet.

Hierzu können zum einen DNA-Moleküle verwendet werden, die die gesamte codierende Sequenz eines

25 Genprodukts einschließlich eventuell vorhandener flankierender Sequenzen umfassen, als auch DNA-Moleküle, die nur Teile der codierenden Sequenz umfassen, wobei diese Teile lang genug sein müssen, um in den Zellen einen antisense-Effekt zu bewirken. Möglich ist auch die Verwendung von DNA-Sequenzen, die einen hohen Grad an Homologie zu den codierenden Sequenzen eines Genprodukts aufweisen, aber nicht vollkommen identisch sind.

30 Bei der Expression von Nucleinsäuremolekülen in Pflanzen kann das synthetisierte Protein in jedem beliebigen Kompartiment der pflanzlichen Zelle lokalisiert sein. Um aber die Lokalisation in einem bestimmten Kompartiment zu erreichen, kann z.B. die codierende Region mit DNA-Sequenzen verknüpft werden, die die Lokalisierung in einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige

35 Sequenzen sind dem Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227). Die Expression der Nucleinsäuremoleküle kann auch in den Organellen der Pflanzenzellen stattfinden.

Die transgenen Pflanzenzellen können nach bekannten Techniken zu ganzen Pflanzen regeneriert werden. Bei den transgenen Pflanzen kann es sich prinzipiell um Pflanzen jeder beliebigen Pflanzenspezies handeln, d.h. sowohl monokotyle als auch dikotyle Pflanzen.

5

So sind transgene Pflanzen erhältlich, die veränderte Eigenschaften durch Überexpression, Suppression oder Inhibierung homologer (= natürlicher) Gene oder Gensequenzen oder Expression heterologer (= fremder) Gene oder Gensequenzen aufweisen.

- 10 Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in transgenen Kulturen eingesetzt werden, welche gegen Wuchsstoffe, wie z.B. Dicamba oder gegen Herbizide, die essentielle Pflanzenenzyme, z.B. Acetolactatsynthasen (ALS), EPSP Synthasen, Glutaminsynthasen (GS) oder Hydroxyphenylpyruvat Dioxygenasen (HPPD) hemmen, respektive gegen Herbizide aus der Gruppe der Sulfonylharnstoffe, der Glyphosate, Glufosinate oder Benzoylisoxazole und analogen
- 15 Wirkstoffe, resistent sind.

Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in transgenen Kulturen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadpflanzen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind,

20 beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes Unkrautspektrum, das bekämpft werden kann, veränderte Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können, vorzugsweise gute Kombinierbarkeit mit den Herbiziden, gegenüber denen die transgene Kultur resistent ist, sowie Beeinflussung von Wuchs und Ertrag der transgenen Kulturpflanzen.

- 25 Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze als Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von Nutz- oder Zierpflanzen, gegebenenfalls in transgenen Kulturpflanzen.

- Bevorzugt ist die Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in Getreide, dabei
- 30 vorzugsweise Mais, Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, oder Reis, im Vor- oder Nachauflauf.

Bevorzugt ist auch die Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in Soja im Vor- oder Nachauflauf.

- 35 Die Verwendung erfindungsgemäßer Verbindungen der Formel (I) zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen schließt auch den Fall ein, bei dem eine Verbindung der

allgemeinen Formel (I) oder deren Salz erst nach der Ausbringung auf der Pflanze, in der Pflanze oder im Boden aus einer Vorläufersubstanz ("Prodrug") gebildet wird.

5 Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung einer oder mehrerer Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salzen bzw. eines erfindungsgemäßen Mittels (wie nachstehend definiert) (in einem Verfahren) zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine wirksame Menge einer oder mehrerer Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salzen auf die Pflanzen (Schadpflanzen, gegebenenfalls zusammen mit den Nutzpflanzen) Pflanzensamen, den Boden, in dem oder auf dem die Pflanzen wachsen, oder die
10 Anbaufläche appliziert.

Gegenstand der Erfindung ist auch ein herbizides und/oder pflanzenwachstumsregulierendes Mittel, dadurch gekennzeichnet, dass das Mittel

15 (a) eine oder mehrere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze enthält wie oben definiert, vorzugsweise in einer der als bevorzugt bzw. besonders bevorzugt gekennzeichneten Ausgestaltung, insbesondere eine oder mehrere Verbindungen der Formeln (I-1) bis (I-301) und/oder deren Salze, jeweils wie oben definiert,

20 und

(b) ein oder mehrere weitere Stoffe ausgewählt aus den Gruppen (i) und/oder (ii):

(i) ein oder mehrere weitere agrochemisch wirksame Stoffe, vorzugsweise ausgewählt aus der
25 Gruppe bestehend aus Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, weiteren Herbiziden (d.h. solche, die nicht der oben definierten allgemeinen Formel (I) entsprechen), Fungiziden, Safenern, Düngemitteln und/oder weiteren Wachstumsregulatoren,

(ii) ein oder mehrere im Pflanzenschutz übliche Formulierungshilfsmittel.
30

Die weiteren agrochemischen wirksamen Stoffe des Bestandteils (i) eines erfindungsgemäßen Mittels sind dabei vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe der Stoffe, die in "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council und the Royal Soc. of Chemistry, 2012 genannt sind.

35 Ein erfindungsgemäßes herbizides oder pflanzenwachstumsregulierendes Mittel, umfasst vorzugsweise ein, zwei, drei oder mehr im Pflanzenschutz übliche Formulierungshilfsmittel (ii) ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Tensiden, Emulgatoren, Dispergiermitteln, Filmbildnern, Verdickungsmitteln,

anorganischen Salzen, Stäubemitteln, bei 25 °C und 1013 mbar festen Trägerstoffen, vorzugsweise adsorptionsfähigen, granulierten Inertmaterialien, Netzmitteln, Antioxidationsmitteln, Stabilisatoren, Puffersubstanzen, Antischaummitteln, Wasser, organischen Lösungsmitteln, vorzugsweise bei 25 °C und 1013 mbar mit Wasser in jedem beliebigen Verhältnis mischbare organische Lösungsmittel.

5

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze enthalten.

10

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage:

15

Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikro kapseln und Wachse.

20

Diese einzelnen Formulierungstypen und die Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind dem Fachmann bekannt, und werden beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

30

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z.B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalin-sulfonsaures Natrium

35

oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

5

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykoether, Fettalkoholpolyglykoether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z.B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

10

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch

15

Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen

20

Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes

Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln,

25

z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

30

Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt.

Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulaten siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.

5

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

10

Die agrochemischen Zubereitungen, vorzugsweise herbizide oder pflanzenwachstumsregulierende Mittel der vorliegenden Erfindung enthalten vorzugsweise eine Gesamtmenge von 0,1 bis 99 Gew.-%, bevorzugt 0,5 bis 95 Gew.-%, weiter bevorzugt 1 bis 90 Gew.-%, insbesondere bevorzugt 2 bis 80 Gew.-%, an Wirkstoffen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen.

15

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0,05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

25

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösungsmittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel. Beispiele für Formulierungshilfsmittel sind unter anderem in "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", ed. D. A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998) beschrieben.

30

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze können als solche oder in Form ihrer Zubereitungen (Formulierungen) mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Herbiziden, Fungiziden, Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren kombiniert eingesetzt werden, z.B. als Fertigformulierung oder als Tankmischungen. Die Kombinationsformulierungen können dabei auf Basis der obengenannten

35

Formulierungen hergestellt werden, wobei die physikalischen Eigenschaften und Stabilitäten der zu kombinierenden Wirkstoffe zu berücksichtigen sind.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in
5 Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe, die auf einer Inhibition von beispielsweise Acetolactat-Synthase, Acetyl-CoA-Carboxylase, Cellulose-Synthase, Enolpyruvylshikimat-3-phosphat-Synthase, Glutamin-Synthetase, p-Hydroxyphenylpyruvat-Dioxygenase, Phytoendesaturase, Photosystem I, Photosystem II, Protoporphyrinogen-Oxidase beruhen, einsetzbar, wie sie z.B. in Weed Research 26 (1986) 441-445 oder "The Pesticide Manual", 16th edition,
10 The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012 und der dort zitierten Literatur beschrieben sind.

Von besonderem Interesse ist die selektive Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen. Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bereits in
15 vielen Kulturen sehr gute bis ausreichende Selektivität aufweisen, können prinzipiell in einigen Kulturen und vor allem auch im Falle von Mischungen mit anderen Herbiziden, die weniger selektiv sind, Phytotoxizitäten an den Kulturpflanzen auftreten. Diesbezüglich sind Kombinationen erfindungsgemäßer Verbindungen (I) von besonderem Interesse, welche die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. deren Kombinationen mit anderen Herbiziden oder Pestiziden und
20 Safenern enthalten. Die Safener, welche in einem antidotisch wirksamen Gehalt eingesetzt werden, reduzieren die phytotoxischen Nebenwirkungen der eingesetzten Herbizide/Pestizide, z.B. in wirtschaftlich bedeutenden Kulturen wie Getreide (Weizen, Gerste, Roggen, Mais, Reis, Hirse), Zuckerrübe, Zuckerrohr, Raps, Baumwolle und Soja, vorzugsweise Getreide.

25 Die Gewichtsverhältnisse von Herbizid(mischung) zu Safener hängt im Allgemeinen von der Aufwandmenge an Herbizid und der Wirksamkeit des jeweiligen Safeners ab und kann innerhalb weiter Grenzen variieren, beispielsweise im Bereich von 200:1 bis 1:200, vorzugsweise 100:1 bis 1:100, insbesondere 20:1 bis 1:20. Die Safener können analog den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Mischungen mit weiteren Herbiziden/Pestiziden formuliert werden und als
30 Fertigformulierung oder Tankmischung mit den Herbiziden bereitgestellt und angewendet werden.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Herbizid- oder Herbizid-Safener-Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubbörmige
35 Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Äußere Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit etc. beeinflussen zu einem gewissen Teil die Aufwandmenge der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze. Die Aufwandmenge kann dabei innerhalb weiter Grenzen variieren. Für die Anwendung als Herbizid zur Bekämpfung von Schadpflanzen liegt die Gesamtmenge an Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salze vorzugsweise im Bereich von 0,001 bis 10,0 kg/ha, bevorzugt im Bereich von 0,005 bis 5 kg/ha, weiter bevorzugt im Bereich von 0,01 bis 1,5 kg/ha, insbesondere bevorzugt im Bereich von 0,05 bis 1 kg/ha. Dies gilt sowohl für die Anwendung im Voraufbau oder im Nachaufbau.

Bei der Anwendung von erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salzen als Pflanzenwachstumsregulator, beispielsweise als Halmverkürzer bei Kulturpflanzen, wie sie oben genannt worden sind, vorzugsweise bei Getreidepflanzen wie Weizen, Gerste, Roggen, Triticale, Hirse, Reis oder Mais, liegt die Gesamt-Aufwandmenge vorzugsweise im Bereich von 0,001 bis 2 kg/ha, vorzugsweise im Bereich von 0,005 bis 1 kg/ha, insbesondere im Bereich von 10 bis 500 g/ha, ganz besonders bevorzugt im Bereich von 20 bis 250 g/ha. Dies gilt sowohl für die Anwendung im Voraufbau oder im Nachaufbau.

Die Applikation als Halmverkürzer kann in verschiedenen Stadien des Wachstums der Pflanzen erfolgen. Bevorzugt ist beispielsweise die Anwendung nach der Bestockung am Beginn des Längenwachstums.

Alternativ kommt bei der Anwendung als Pflanzenwachstumsregulator auch die Behandlung des Saatguts in Frage, welche die unterschiedlichen Saatgutbeiz- und Beschichtungstechniken einschließt. Die Aufwandmenge hängt dabei von den einzelnen Techniken ab und kann in Vorversuchen ermittelt werden.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in erfindungsgemäßen Mitteln (z.B. Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix) sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe, die auf einer Inhibition von beispielsweise Acetolactat-Synthase, Acetyl-CoA-Carboxylase, Cellulose-Synthase, Enolpyruvylshikimat-3-phosphat-Synthase, Glutamin-Synthetase, p-Hydroxyphenylpyruvat-Dioxygenase, Phytoendesaturase, Photosystem I, Photosystem II oder Protoporphyrinogen-Oxidase beruhen, einsetzbar, wie sie z.B. aus Weed Research 26 (1986) 441-445 oder "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council und the Royal Soc. of Chemistry, 2012 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Nachfolgend werden beispielhaft bekannte Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren genannt, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, wobei diese Wirkstoffe entweder mit ihrem "common name" in der englischsprachigen Variante gemäß International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen bzw. mit der Codenummer bezeichnet sind. Dabei sind stets sämtliche

Anwendungsformen wie beispielsweise Säuren, Salze, Ester sowie auch alle isomeren Formen wie Stereoisomere und optische Isomere umfaßt, auch wenn diese nicht explizit erwähnt sind.

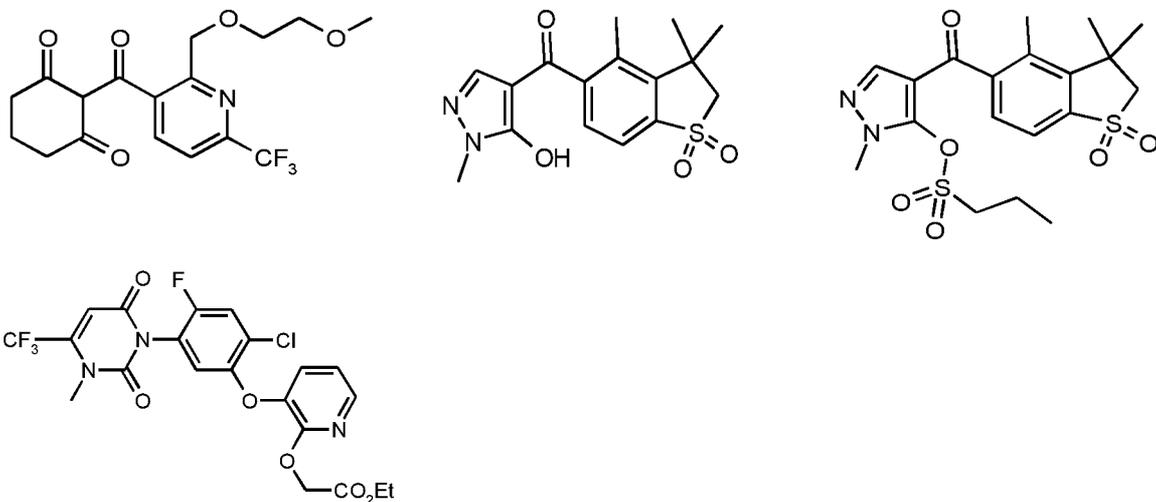
Beispiele für solche herbiziden Mischungspartner sind:

- 5 Acetochlor, acifluorfen, acifluorfen-sodium, aclonifen, alachlor, allidochlor, alloxydim, alloxydim-sodium, ametryn, amicarbazone, amidochlor, amidosulfuron, 4-amino-3-chloro-6-(4-chloro-2-fluoro-3-methylphenyl)-5-fluoropyridine-2-carboxylic acid, aminocyclopyrachlor, aminocyclopyrachlor-potassium, aminocyclopyrachlor-methyl, aminopyralid, amitrole, ammoniumsulfamate, anilofos, asulam, atrazine, azafenidin, azimsulfuron, beflubutamid, benazolin, benazolin-ethyl, benfluralin,
- 10 benfuresate, bensulfuron, bensulfuron-methyl, bensulide, bentazone, benzobicyclon, benzofenap, bicyclopyron, bifenox, bilanafos, bilanafos-sodium, bispyribac, bispyribac-sodium, bromacil, bromobutide, bromofenoxim, bromoxynil, bromoxynil-butyrate, -potassium, -heptanoate und -octanoate, busoxinone, butachlor, butafenacil, butamifos, butenachlor, butralin, butroxydim, butylate, cafenstrole, carbetamide, carfentrazone, carfentrazone-ethyl, chloramben, chlorbromuron, chlorfenac, chlorfenac-
- 15 sodium, chlorfenprop, chlorflurenol, chlorflurenol-methyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-ethyl, chlorophthalim, chlorotoluron, chlorthal-dimethyl, chlorsulfuron, cinidon, cinidon-ethyl, cinmethylin, cinosulfuron, clacyfos, clethodim, clodinafop, clodinafop-propargyl, clomazone, clomeprop, clopyralid, cloransulam, cloransulam-methyl, cumyluron, cyanamide, cyanazine, cycloate, cyclopyrimorate, cyclosulfamuron, cycloxydim, cyhalofop, cyhalofop-butyl, cyprazine, 2,4-D, 2,4-D-butotyl, -butyl, -
- 20 dimethylammonium, -diolamin, -ethyl, 2-ethylhexyl, -isobutyl, -isooctyl, -isopropylammonium, -potassium, -triisopropanolammonium und -trolamine, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, -dimethylammonium, isooctyl, -potassium und -sodium, daimuron (dymron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedipham, detosyl-pyrazolate (DTP), dicamba, dichlobenil, 2-(2,4-dichlorobenzyl)-4,4-dimethyl-1,2-oxazolidin-3-one, 2-(2,5-dichlorobenzyl)-4,4-dimethyl-1,2-oxazolidin-3-one, dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop,
- 25 diclofop-methyl, diclofop-P-methyl, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, diflufenzopyr-sodium, dimefuron, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dimethenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramine, dinoterb, diphenamid, diquat, diquat-dibromid, dithiopyr, diuron, DNOC, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron, ethametsulfuron-methyl, ethiozin, ethofumesate, ethoxyfen, ethoxyfen-ethyl, ethoxysulfuron, etobenzanid, F-9600, F-5231, i.e. N-[2-
- 30 Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid, F-7967, i.e. 3-[7-Chlor-5-fluor-2-(trifluormethyl)-1H-benzimidazol-4-yl]-1-methyl-6-(trifluormethyl)pyrimidin-2,4(1H,3H)-dion, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-ethyl, fenoxaprop-P-ethyl, fenoxasulfone, fenquino-trione, fentrazamide, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-methyl, flazasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl,
- 35 flucarbazone, flucarbazone-sodium, flucetosulfuron, fluchloralin, flufenacet, flufenpyr, flufenpyr-ethyl, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butyl, -dimethylammonium und -methyl, fluoroglycofen, fluoroglycofen-ethyl, flupropanate, flupyrsulfuron,

flupyr-sulfuron-methyl-sodium, fluridone, flurochloridone, fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl, flurtamone, fluthiacet, fluthiacet-methyl, fomesafen, fomesafen-sodium, foramsulfuron, fosamine, glufosinate, glufosinate-ammonium, glufosinate-P-sodium, glufosinate-P-ammonium, glufosinate-P-sodium, glyphosate, glyphosate-ammonium, -isopropylammonium, -diammonium, -dimethylammonium, -potassium, -sodium und -trimesium, H-9201, i.e. O-(2,4-Dimethyl-6-nitrophenyl)-O-ethyl-
5 isopropylphosphoramidothioat, halauxifen, halauxifen-methyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-methyl, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-ethoxyethyl, haloxyfop-P-ethoxyethyl, haloxyfop-methyl, haloxyfop-P-methyl, hexazinone, HW-02, i.e. 1-(Dimethoxyphosphoryl)-ethyl-(2,4-dichlorphenoxy)acetat, imazamethabenz, Imazamethabenz-methyl, imazamox, imazamox-ammonium, imazapic, imazapic-ammonium, imazapyr, imazapyr-isopropylammonium, imazaquin, imazaquin-
10 ammonium, imazethapyr, imazethapyr-immonium, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, iodosulfuron, iodosulfuron-methyl-sodium, ioxynil, ioxynil-octanoate, -potassium und sodium, ipfencarbazone, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutole, karbutilate, KUH-043, i.e. 3-({[5-(Difluormethyl)-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]methyl}sulfonyl)-5,5-dimethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol,
15 ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPA-butotyl, -dimethylammonium, -2-ethylhexyl, -isopropylammonium, -potassium und -sodium, MCPB, MCPB-methyl, -ethyl und -sodium, mecoprop, mecoprop-sodium, und -butotyl, mecoprop-P, mecoprop-P-butotyl, -dimethylammonium, -2-ethylhexyl und -potassium, mefenacet, mefluidide, mesosulfuron, mesosulfuron-methyl, mesotrione, methabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitron, metazachlor, metazosulfuron,
20 methabenzthiazuron, methiopyrsulfuron, methiozolin, methyl isothiocyanate, metobromuron, metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-methyl, molinat, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron-ester, MT-5950, i.e. N-[3-chlor-4-(1-methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid, NGGC-011, napropamide, NC-310, i.e. 4-(2,4-Dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxy-pyrazol, neburon, nicosulfuron, nonanoic acid (Pelargonsäure), norflurazon, oleic acid (fatty
25 acids), orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxyfluorfen, paraquat, paraquat dichloride, pebulate, pendimethalin, penoxsulam, pentachlorphenol, pentoxazone, pethoxamid, petroleum oils, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-methyl, prodiamine, profoxydim, prometon, prometryn, propachlor, propanil, propaquizafop, propazine, propham, propisochlor, propoxycarbazone,
30 propoxycarbazone-sodium, propyrisulfuron, propyzamide, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclonil, pyraflufen, pyraflufen-ethyl, pyrasulfotole, pyrazolynate (pyrazolate), pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-ethyl, pyrazoxyfen, pyribambenz, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridate, pyrifitalid, pyriminobac, pyriminobac-methyl, pyrimisulfan, pyri-thiobac, pyri-thiobac-sodium, pyroxasulfone, pyroxulam, quinclorac, quinmerac, quino-clamine,
35 quizalofop, quizalofop-ethyl, quizalofop-P, quizalofop-P-ethyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenacil, sethoxydim, siduron, simazine, simetryn, SL-261, sulcotrion, sulfentrazone, sulfometuron, sulfometuron-methyl, sulfosulfuron, , SYN-523, SYP-249, i.e. 1-Ethoxy-3-methyl-1-oxobut-3-en-2-yl-

5-[2-chlor-4-(trifluormethyl)phenoxy]-2-nitrobenzoat, SYP-300, i.e. 1-[7-Fluor-3-oxo-4-(prop-2-in-1-yl)-3,4-dihydro-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]-3-propyl-2-thioxoimidazolidin-4,5-dion, 2,3,6-TBA, TCA (Trifluoressigsäure), TCA-sodium, tebuthiuron, tefuryltrione, tembotrione, tepraloxydim, terbacil, terbucarb, terbumeton, terbuthylazin, terbutryn, thenylchlor, thiazopyr, thiencarbazon, thiencarbazonemethyl, thifensulfuron, thifensulfuron-methyl, thiobencarb, tiafenacil, tolpyralate, topramezone, tralkoxydim, triafamone, tri-allate, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, tribenuron-methyl, triclopyr, trietazine, trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-sodium, trifludimoxazin, trifluralin, triflusulfuron, triflusulfuron-methyl, tritosulfuron, urea sulfate, vernolate, XDE-848, ZJ-0862, i.e. 3,4-Dichlor-N-{2-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy]benzyl}anilin, sowie die folgenden Verbindungen:

10



Beispiele für Pflanzenwachstumsregulatoren als mögliche Mischungspartner sind:

Acibenzolar, acibenzolar-S-methyl, 5-Aminolävulinsäure, ancymidol, 6-benzylaminopurine,

Brassinolid, Catechin, chlormequat chloride, cloprop, cyclanilide, 3-(Cycloprop-1-enyl)propionsäure,

15 daminozide, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-sodium, endothal, endothal-

dipotassium, -disodium, und mono(N,N-dimethylalkylammonium), ethephon, flumetralin, flurenol,

flurenol-butyl, flurprimidol, forchlorfenuron, gibberellic acid, inabenfide, indol-3-acetic acid (IAA), 4-

indol-3-ylbutyric acid, isoprothiolane, probenazole, Jasmonsäure, Jasmonsäuremethylester, maleic

hydrazide, mepiquat chloride, 1-methylcyclopropene, 2-(1-naphthyl)acetamide, 1-naphthylacetic acid, 2-

20 naphthyloxyacetic acid, nitrophenolate-mixture, 4-Oxo-4[(2-phenylethyl)amino]buttersäure,

paclobutrazol, N-phenylphthalamic acid, prohexadione, prohexadione-calcium, prohydrojasmon,

Salicylsäure, Strigolacton, tecnazene, thidiazuron, triacantanol, trinexapac, trinexapac-ethyl, tsitodef,

uniconazole, uniconazole-P.

25 Ebenfalls als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) kommen beispielsweise die folgenden Safener in Frage:

- S1) Verbindungen aus der Gruppe heterocyclischer Carbonsäurederivate:
- S1^a) Verbindungen vom Typ der Dichlorphenylpyrazolin-3-carbonsäure (S1^a), vorzugsweise Verbindungen wie
- 5 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäure,
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäureethylester (S1-1) ("Mefenpyr-diethyl"), und verwandte Verbindungen, wie sie in der WO-A-91/07874 beschrieben sind;
- S1^b) Derivate der Dichlorphenylpyrazolcarbonsäure (S1^b), vorzugsweise Verbindungen wie
- 10 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-methylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-2),
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-isopropylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-3),
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(1,1-dimethyl-ethyl)pyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-4) und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-333131 und EP-A-269806 beschrieben sind;
- S1^c) Derivate der 1,5-Diphenylpyrazol-3-carbonsäure (S1^c), vorzugsweise Verbindungen wie
- 15 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-phenylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-5),
1-(2-Chlorphenyl)-5-phenylpyrazol-3-carbonsäuremethylester (S1-6) und verwandte Verbindungen wie sie beispielsweise in der EP-A-268554 beschrieben sind;
- S1^d) Verbindungen vom Typ der Triazolcarbonsäuren (S1^d), vorzugsweise Verbindungen wie Fenchlorazol(-ethylester), d.h. 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-trichlormethyl-(1H)-1,2,4-triazol-3-carbonsäureethylester (S1-7), und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-174562 und
- 20 EP-A-346620 beschrieben sind;
- S1^e) Verbindungen vom Typ der 5-Benzyl- oder 5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure, oder der 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure(S1^e), vorzugsweise Verbindungen wie
- 25 5-(2,4-Dichlorbenzyl)-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-8) oder
5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-9) und verwandte Verbindungen, wie sie in WO-A-91/08202 beschrieben sind, bzw. 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-carbonsäure (S1-10) oder
5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-11) ("Isoxadifen-ethyl")
oder -n-propylester (S1-12) oder 5-(4-Fluorphenyl)-5-phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-13), wie sie in der Patentanmeldung WO-A-95/07897 beschrieben sind.
- S2) Verbindungen aus der Gruppe der 8-Chinolinoxiderivate (S2):
- 30 S2^a) Verbindungen vom Typ der 8-Chinolinoxinessigsäure (S2^a), vorzugsweise
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-(1-methylhexyl)-ester ("Cloquintocet-mexyl") (S2-1),
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-(1,3-dimethyl-but-1-yl)-ester (S2-2),
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-4-allyl-oxy-butylester (S2-3),
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-1-allyloxy-prop-2-ylester (S2-4),
- 35 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäureethylester (S2-5),
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäuremethylester (S2-6),
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäureallyylester (S2-7),

(5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure-2-(2-propyliden-iminoxy)-1-ethylester (S2-8),
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure-2-oxo-prop-1-ylester (S2-9) und verwandte Verbindungen,
 wie sie in EP-A-86750, EP-A-94349 und EP-A-191736 oder EP-A-0 492 366 beschrieben sind,
 sowie (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure (S2-10), deren Hydrate und Salze, beispielsweise
 deren Lithium-, Natrium-, Kalium-, Kalzium-, Magnesium-, Aluminium-, Eisen-, Ammonium-,
 quartäre Ammonium-, Sulfonium-, oder Phosphoniumsalze wie sie in der WO-A-2002/34048
 beschrieben sind;

S2^b) Verbindungen vom Typ der (5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäure (S2^b), vorzugsweise
 Verbindungen wie (5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäurediethylester,

(5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäurediallylester,

(5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäure-methyl-ethylester und verwandte Verbindungen, wie sie in
 EP-A-0 582 198 beschrieben sind.

S3) Wirkstoffe vom Typ der Dichloracetamide (S3), die häufig als Voraufaufsafener
 (bodenwirksame Safener) angewendet werden, wie z. B.

"Dichlormid" (N,N-Diallyl-2,2-dichloracetamid) (S3-1),

"R-29148" (3-Dichloracetyl-2,2,5-trimethyl-1,3-oxazolidin) der Firma Stauffer (S3-2),

"R-28725" (3-Dichloracetyl-2,2,-dimethyl-1,3-oxazolidin) der Firma Stauffer (S3-3),

"Benoxacor" (4-Dichloracetyl-3,4-dihydro-3-methyl-2H-1,4-benzoxazin) (S3-4),

"PPG-1292" (N-Allyl-N-[(1,3-dioxolan-2-yl)-methyl]-dichloracetamid) der Firma PPG
 Industries (S3-5),

"DKA-24" (N-Allyl-N-[(allylaminocarbonyl)methyl]-dichloracetamid) der Firma Sagro-Chem
 (S3-6),

"AD-67" oder "MON 4660" (3-Dichloracetyl-1-oxa-3-aza-spiro[4,5]decan) der Firma
 Nitrokemia bzw. Monsanto (S3-7),

"TI-35" (1-Dichloracetyl-azepan) der Firma TRI-Chemical RT (S3-8),

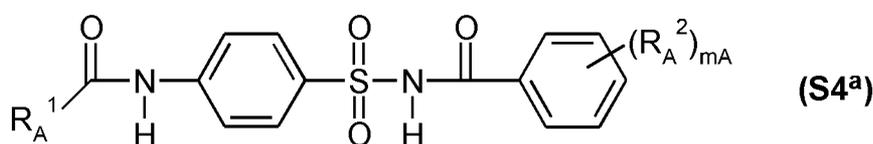
"Diclonon" (Dicyclonon) oder "BAS145138" oder "LAB145138" (S3-9)

((RS)-1-Dichloracetyl-3,3,8a-trimethylperhydropyrrolo[1,2-a]pyrimidin-6-on) der Firma BASF,

"Furilazol" oder "MON 13900" ((RS)-3-Dichloracetyl-5-(2-furyl)-2,2-dimethyloxazolidin)
 (S3-10), sowie dessen (R)-Isomer (S3-11).

S4) Verbindungen aus der Klasse der Acylsulfonamide (S4):

S4^a) N-Acylsulfonamide der Formel (S4^a) und deren Salze wie sie in der WO-A-97/45016
 beschrieben sind,



worin

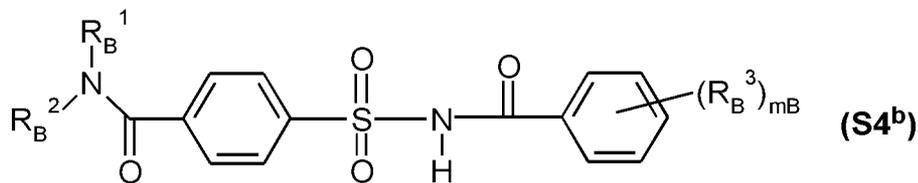
R_A^1 (C₁-C₆)Alkyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, wobei die 2 letztgenannten Reste durch v_A Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₆)Haloalkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch durch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert sind;

5 R_A^2 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, CF₃;

m_A 1 oder 2;

v_A ist 0, 1, 2 oder 3 bedeuten;

10 S4^b) Verbindungen vom Typ der 4-(Benzoylsulfamoyl)benzamide der Formel (S4^b) und deren Salze, wie sie in der WO-A-99/16744 beschrieben sind,



worin

R_B^1 , R_B^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₃-C₆)Alkenyl, (C₃-C₆)Alkynyl,

15 R_B^3 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy und

m_B 1 oder 2 bedeuten,

z.B. solche worin

R_B^1 = Cyclopropyl, R_B^2 = Wasserstoff und (R_B^3) = 2-OMe ist ("Cyprosulfamide", S4-1),

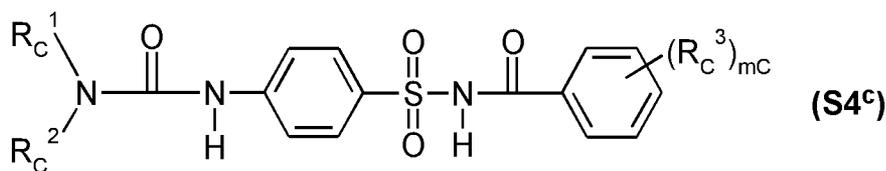
R_B^1 = Cyclopropyl, R_B^2 = Wasserstoff und (R_B^3) = 5-Cl-2-OMe ist (S4-2),

20 R_B^1 = Ethyl, R_B^2 = Wasserstoff und (R_B^3) = 2-OMe ist (S4-3),

R_B^1 = Isopropyl, R_B^2 = Wasserstoff und (R_B^3) = 5-Cl-2-OMe ist (S4-4) und

R_B^1 = Isopropyl, R_B^2 = Wasserstoff und (R_B^3) = 2-OMe ist (S4-5);

S4^c) Verbindungen aus der Klasse der Benzoylsulfamoylphenylharnstoffe der Formel (S4^c), wie sie in der EP-A-365484 beschrieben sind,



25

worin

R_C^1 , R_C^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, (C₃-C₈)Cycloalkyl, (C₃-C₆)Alkenyl, (C₃-C₆)Alkynyl,

R_C^3 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, CF₃ und

30 m_C 1 oder 2 bedeuten;

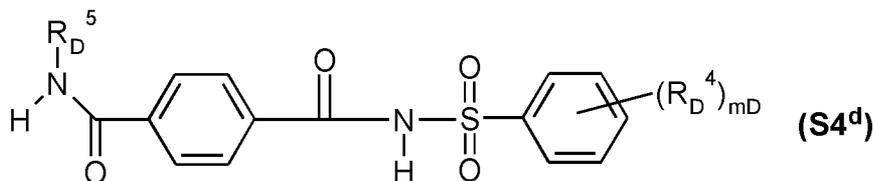
beispielsweise

1-[4-(N-2-Methoxybenzoylsulfamoyl)phenyl]-3-methylharnstoff,

1-[4-(N-2-Methoxybenzoylsulfamoyl)phenyl]-3,3-dimethylharnstoff,

1-[4-(N-4,5-Dimethylbenzoylsulfamoyl)phenyl]-3-methylharnstoff;

S4^d) Verbindungen vom Typ der N-Phenylsulfonylterephthalamide der Formel (S4^d) und deren Salze,
5 die z.B. bekannt sind aus CN 101838227,



worin

R_D⁴ Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, CF₃;

m_D 1 oder 2;

10 R_D⁵ Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkynyl, (C₅-C₆)Cycloalkenyl bedeutet.

S5) Wirkstoffe aus der Klasse der Hydroxyaromaten und der aromatisch-aliphatischen Carbonsäurederivate (S5), z.B.

3,4,5-Triacetoxybenzoesäureethylester, 3,5-Dimethoxy-4-hydroxybenzoesäure, 3,5-

15 Dihydroxybenzoesäure, 4-Hydroxysalicylsäure, 4-Fluorsalicylsäure, 2-Hydroxyzimtsäure, 2,4-Dichlorzimtsäure, wie sie in der WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001 beschrieben sind.

S6) Wirkstoffe aus der Klasse der 1,2-Dihydrochinoxalin-2-one (S6), z.B.

1-Methyl-3-(2-thienyl)-1,2-dihydrochinoxalin-2-on, 1-Methyl-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-

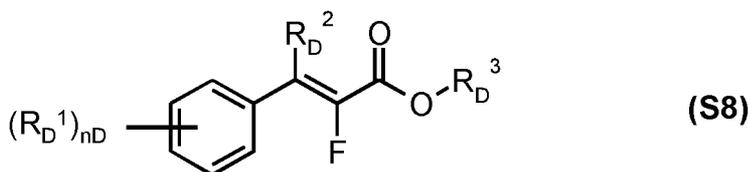
20 chinoxalin-2-thion, 1-(2-Aminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-on-hydrochlorid, 1-(2-Methylsulfonylaminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-on, wie sie in der WO-A-2005/112630 beschrieben sind.

S7) Verbindungen aus der Klasse der Diphenylmethoxyessigsäurederivate (S7), z.B.

Diphenylmethoxyessigsäuremethylester (CAS-Reg.Nr. 41858-19-9) (S7-1),

25 Diphenylmethoxyessigsäureethylester oder Diphenylmethoxyessigsäure wie sie in der WO-A-98/38856 beschrieben sind.

S8) Verbindungen der Formel (S8), wie sie in der WO-A-98/27049 beschrieben sind,



worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

30 R_D¹ ist Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy,

R_D² ist Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl,

R_D^3 ist Wasserstoff, (C_1-C_8) Alkyl, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkynyl, oder Aryl, wobei jeder der vorgenannten C-haltigen Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe, bestehend aus Halogen und Alkoxy substituiert ist; oder deren Salze,

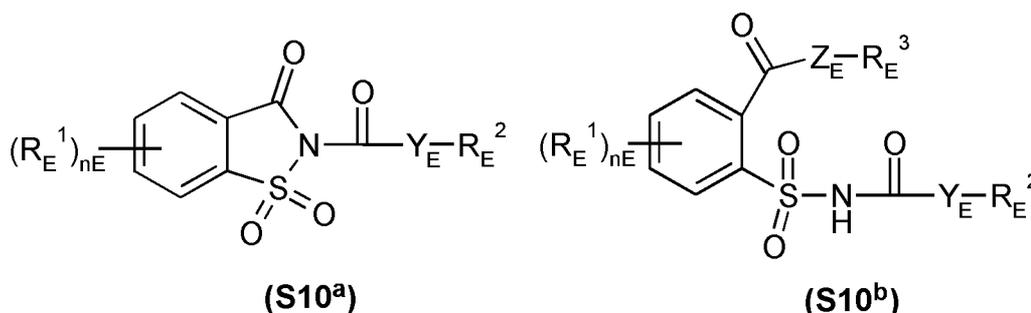
5 n_D ist eine ganze Zahl von 0 bis 2.

S9) Wirkstoffe aus der Klasse der 3-(5-Tetrazolylcarbonyl)-2-chinolone (S9), z.B.

1,2-Dihydro-4-hydroxy-1-ethyl-3-(5-tetrazolylcarbonyl)-2-chinolon (CAS-Reg.Nr.: 219479-18-2), 1,2-Dihydro-4-hydroxy-1-methyl-3-(5-tetrazolylcarbonyl)-2-chinolon (CAS-Reg.Nr. 95855-00-8), wie sie in der WO-A-1999/000020 beschrieben sind.

10 S10) Verbindungen der Formeln (S10^a) oder (S10^b),

wie sie in der WO-A-2007/023719 und WO-A-2007/023764 beschrieben sind,



worin

R_E^1 Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, Methoxy, Nitro, Cyano, CF_3 , OCF_3

Y_E, Z_E unabhängig voneinander O oder S,

15 n_E eine ganze Zahl von 0 bis 4,

R_E^2 (C_1-C_{16}) Alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, Aryl; Benzyl, Halogenbenzyl,

R_E^3 Wasserstoff oder (C_1-C_6) Alkyl bedeuten.

S11) Wirkstoffe vom Typ der Oxyimino-Verbindungen (S11), die als Saatbeizmittel bekannt sind, wie z. B.

20 "Oxabetrinil" ((Z)-1,3-Dioxolan-2-ylmethoxyimino(phenyl)acetonitril) (S11-1), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist,

"Fluxofenim" (1-(4-Chlorphenyl)-2,2,2-trifluor-1-ethanon-O-(1,3-dioxolan-2-ylmethyl)-oxim) (S11-2), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist, und

"Cyometrinil" oder "CGA-43089" ((Z)-Cyanomethoxyimino(phenyl)acetonitril) (S11-3), das als

25 Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist.

S12) Wirkstoffe aus der Klasse der Isothiochromanone (S12), wie z.B. Methyl-[(3-oxo-1H-2-benzothiopyran-4(3H)-yliden)methoxy]acetat (CAS-Reg.Nr. 205121-04-6) (S12-1) und verwandte Verbindungen aus WO-A-1998/13361.

S13) Eine oder mehrere Verbindungen aus Gruppe (S13):

30 "Naphthalic anhydrid" (1,8-Naphthalindicarbonsäureanhydrid) (S13-1), das als Saatbeiz-Safener für Mais gegen Schäden von Thiocarbamatherbiziden bekannt ist,

"Fencloirim" (4,6-Dichlor-2-phenylpyrimidin) (S13-2), das als Safener für Pretilachlor in gesätem Reis bekannt ist,

"Flurazole" (Benzyl-2-chlor-4-trifluormethyl-1,3-thiazol-5-carboxylat) (S13-3), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Alachlor und Metolachlor bekannt ist,

5 "CL 304415" (CAS-Reg.Nr. 31541-57-8)

(4-Carboxy-3,4-dihydro-2H-1-benzopyran-4-essigsäure) (S13-4) der Firma American Cyanamid, das als Safener für Mais gegen Schäden von Imidazolinonen bekannt ist,

"MG 191" (CAS-Reg.Nr. 96420-72-3) (2-Dichlormethyl-2-methyl-1,3-dioxolan) (S13-5) der Firma Nitrokemia, das als Safener für Mais bekannt ist,

10 "MG 838" (CAS-Reg.Nr. 133993-74-5)

(2-propenyl 1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan-4-carbodithioat) (S13-6) der Firma Nitrokemia

"Disulfoton" (O,O-Diethyl S-2-ethylthioethyl phosphordithioat) (S13-7),

"Dietholate" (O,O-Diethyl-O-phenylphosphorothioat) (S13-8),

"Mephenate" (4-Chlorphenyl-methylcarbamat) (S13-9).

15 S14) Wirkstoffe, die neben einer herbiziden Wirkung gegen Schadpflanzen auch Safenerwirkung an Kulturpflanzen wie Reis aufweisen, wie z. B.

"Dimepiperate" oder "MY-93" (S-1-Methyl-1-phenylethyl-piperidin-1-carbothioat), das als Safener für Reis gegen Schäden des Herbizids Molinate bekannt ist,

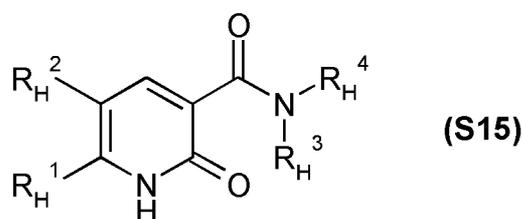
"Daimuron" oder "SK 23" (1-(1-Methyl-1-phenylethyl)-3-p-tolyl-harnstoff), das als Safener für 20 Reis gegen Schäden des Herbizids Imazosulfuron bekannt ist,

"Cumyluron" = "JC-940" (3-(2-Chlorphenylmethyl)-1-(1-methyl-1-phenyl-ethyl)harnstoff, siehe JP-A-60087270), das als Safener für Reis gegen Schäden einiger Herbizide bekannt ist,

"Methoxyphenon" oder "NK 049" (3,3'-Dimethyl-4-methoxy-benzophenon), das als Safener für Reis gegen Schäden einiger Herbizide bekannt ist,

25 "CSB" (1-Brom-4-(chlormethylsulfonyl)benzol) von Kumiai, (CAS-Reg.Nr. 54091-06-4), das als Safener gegen Schäden einiger Herbizide in Reis bekannt ist.

S15) Verbindungen der Formel (S15) oder deren Tautomere,



wie sie in der WO-A-2008/131861 und WO-A-2008/131860 beschrieben sind,

30 worin

R_H^1 einen (C₁-C₆)Haloalkylrest bedeutet und

R_H^2 Wasserstoff oder Halogen bedeutet und

R_H^3 , R_H^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₁₆)Alkyl, (C₂-C₁₆)Alkenyl oder (C₂-C₁₆)Alkynyl,

wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, Cyano, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylamino, Di[(C₁-C₄)alkyl]-amino, [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Haloalkoxy]-carbonyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, Phenyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, und Heterocyclyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, substituiert ist,

oder (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₄-C₆)Cycloalkenyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, das an einer Seite des Rings mit einem 4 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen Ring kondensiert ist, oder (C₄-C₆)Cycloalkenyl, das an einer Seite des Rings mit einem 4 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen Ring kondensiert ist,

wobei jeder der letztgenannten 4 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylamino, Di[(C₁-C₄)alkyl]-amino, [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Haloalkoxy]-carbonyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, Phenyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, und Heterocyclyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, substituiert ist,

bedeutet oder

R_H^3 (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₂-C₄)Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkinyloxy oder (C₂-C₄)Haloalkoxy bedeutet und R_H^4 Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeutet oder

R_H^3 und R_H^4 zusammen mit dem direkt gebundenen N-Atom einen vier- bis achtegliedrigen heterocyclischen Ring, der neben dem N-Atom auch weitere Heteroringatome, vorzugsweise bis zu zwei weitere Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio substituiert ist, bedeutet.

S16) Wirkstoffe, die vorrangig als Herbizide eingesetzt werden, jedoch auch Safenerwirkung auf Kulturpflanzen aufweisen, z. B.

(2,4-Dichlorphenoxy)essigsäure (2,4-D),

(4-Chlorphenoxy)essigsäure,

(R,S)-2-(4-Chlor-o-tolyloxy)propionsäure (Mecoprop),

4-(2,4-Dichlorphenoxy)buttersäure (2,4-DB),

(4-Chlor-o-tolyloxy)essigsäure (MCPA),

4-(4-Chlor-o-tolyloxy)buttersäure,

4-(4-Chlorphenoxy)buttersäure,

3,6-Dichlor-2-methoxybenzoesäure (Dicamba),
1-(Ethoxycarbonyl)ethyl-3,6-dichlor-2-methoxybenzoat (Lactidichlor-ethyl).

5 Bevorzugte Safener in Kombination mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze, insbesondere mit den Verbindungen der Formeln (I-1) bis (I-301) und/oder deren Salze, sind: Cloquintocet-mexyl, Cyprosulfamid, Fenchlorazol-ethylester, Isoxadifen-ethyl, Mefenpyr-diethyl, Fenclorim, Cumyluron, S4-1 und S4-5, und besonders bevorzugte Safener sind: Cloquintocet-mexyl, Cyprosulfamid, Isoxadifen-ethyl und Mefenpyr-diethyl.

10 Biologische Beispiele

A. Herbizide Wirkung im Nachauflauf bei 320 g/ha

15 Samen von mono- bzw. dikotylen Unkrautpflanzen wurden in Kunststofftöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt (Doppelaussaaten mit jeweils einer Spezies mono- bzw. dikotyler Unkrautpflanzen pro Topf), mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter kontrollierten Wachstumsbedingungen angezogen. 2 bis 3 Wochen nach der Aussaat wurden die Versuchspflanzen im Einblattstadium behandelt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden als wässrige Suspension bzw. Emulsion, unter Zusatz von 0,5% Additiv, mit
20 einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 Liter pro Hektar, auf die grünen Pflanzenteile appliziert. Nach ca. 3 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus, unter optimalen Wachstumsbedingungen, wurde die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert.

Beispielsweise bedeutet 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0% Wirkung = wie
25 Kontrollpflanzen.

In den nachstehenden Tabellen A1 bis A11 sind die Wirkungen ausgewählter Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Tabelle 1 auf verschiedene Schadpflanzen und einer Aufwandmenge entsprechend 320 g/ha, die gemäß zuvor genannter Versuchsvorschrift erhalten wurden, dargestellt.

Tabelle A1: Nachauflaufwirkung gegen *Abutilon theophrasti* (ABUTH)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ABUTH
I-1	320	90
I-3	320	90
I-6	320	90
I-8	320	90
I-14	320	90
I-41	320	90
I-43	320	90
I-45	320	90
I-178	320	90
I-179	320	90
I-201	320	90
I-277	320	90
I-292	320	90
I-294	320	90
I-298	320	90
I-299	320	90

Tabelle A2: Nachauflaufwirkung gegen *Alopecurus myosuroides* (ALOMY)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ALOMY
I-1	320	90
I-2	320	90
I-5	320	100
I-7	320	90
I-8	320	100
I-11	320	90
I-14	320	100
I-43	320	90

Tabelle A3: Nachauflaufwirkung gegen *Amaranthus retroflexus* (AMARE)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	AMARE
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	90
I-5	320	100
I-7	320	90
I-8	320	100
I-11	320	100
I-13	320	90
I-14	320	90
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-46	320	100
I-178	320	100
I-179	320	90
I-200	320	90
I-277	320	100
I-278	320	100
I-288	320	100
I-289	320	100
I-290	320	100
I-291	320	90
I-292	320	100
I-294	320	100
I-295	320	90
I-296	320	90

Tabelle A4: Nachauflaufwirkung gegen *Digitaria sanguinalis* (DIGSA)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	DIGSA
I-3	320	90
I-5	320	90
I-10	320	100

Tabelle A5: Nachauflaufwirkung gegen Echinochloa crus-galli (ECHCG)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ECHCG
I-7	320	90
I-43	320	90

Tabelle A6: Nachauflaufwirkung gegen Bassia scoparia (KCHSC)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	KCHSC
I-1	320	90
I-3	320	100
I-5	320	90
I-6	320	90
I-8	320	90
I-11	320	90
I-14	320	100
I-41	320	100
I-45	320	90
I-178	320	90
I-179	320	90
I-277	320	100
I-292	320	90
I-295	320	90

5 Tabelle A7: Nachauflaufwirkung gegen Poa annua (POAAN)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	POAAN
I-1	320	90
I-3	320	100
I-6	320	90
I-10	320	100
I-41	320	100
I-43	320	90
I-45	320	100
I-46	320	90
I-178	320	100
I-179	320	90
I-202	320	100
I-277	320	90

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	POAAN
I-288	320	90
I-289	320	90
I-292	320	100
I-294	320	90
I-296	320	90

Tabelle A8: Nachaufwirkung gegen *Stellaria media* (STEME)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	STEME
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	90
I-5	320	90
I-7	320	100
I-8	320	90
I-11	320	100
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-46	320	100
I-178	320	100
I-179	320	100
I-180	320	100
I-200	320	90
I-201	320	90
I-202	320	90
I-277	320	90
I-278	320	90
I-288	320	90
I-289	320	90
I-292	320	100
I-294	320	100
I-295	320	90
I-296	320	100
I-298	320	90
I-299	320	90
I-300	320	90
I-301	320	90

Tabelle A9: Nachauflaufwirkung gegen *Veronica persica* (VERPE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VERPE
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	90
I-11	320	100
I-14	80	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-46	320	100
I-178	320	100
I-179	320	100
I-180	320	90
I-200	320	90
I-201	320	90
I-277	320	90
I-278	320	90
I-288	320	90
I-289	320	90
I-290	320	90
I-291	320	90
I-292	320	100
I-294	320	100
I-295	320	100
I-296	320	100
I-297	320	90
I-298	320	90
I-299	320	90
I-301	320	90

Tabelle A10: Nachauflaufwirkung gegen *Lolium rigidum* (LOLRI)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	LOLRI
I-41	320	90

Tabelle A11: Nachauflaufwirkung gegen *Setaria viridis* (SETVI)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	SETVI
I-41	320	90

Wie die Ergebnisse der Tabellen A1-A11 beispielhaft zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen Nr. I-1, I-2, I-3, I-5, I-6, I-7, I-8, I-10, I-11, I-13, I-14, I-41, I-43, I-45, I-46, I-178, I-179, I-180, I-200, I-201, I-202, I-277, I-278, I-288, I-289, I-290, I-291, I-292, I-294, I-295, I-296, I-297, I-298, I-299, I-300 und I-301 bei Behandlung im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirksamkeit gegen die Schadpflanzen *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Bassia scoparia* (KCHSC), *Lolium rigidum* (LOLRI), *Poa annua* (POAAN), *Setaria viridis* (SETVI), *Stellaria media* (STEME) und *Veronica persica* (VERPE) bei einer Aufwandmenge von 320 g Aktivsubstanz pro Hektar auf.

B. Herbizide Wirkung im Nachauflauf bei 80 g/ha

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen wurden in Kunststoff- oder organischen Pflanztöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter kontrollierten Wachstumsbedingungen angezogen. 2 bis 3 Wochen nach der Aussaat wurden die Versuchspflanzen im Einblattstadium behandelt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion unter Zusatz von 0,5% Additiv mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 l/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach ca. 3 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus, unter optimalen Wachstumsbedingungen, wurde die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Beispielsweise bedeutet 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0% Wirkung = wie Kontrollpflanzen.

In nachstehenden Tabellen B1 bis B6 sind die Wirkungen ausgewählter Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Tabelle 1 auf verschiedene Schadpflanzen und einer Aufwandmenge entsprechend 80 g/ha, die gemäß zuvor genannter Versuchsvorschrift erhalten wurden, dargestellt.

Tabelle B1: Nachauflaufwirkung gegen *Alopecurus myosuroides* (ALOMY)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ALOMY
I-2	80	90
I-3	80	90
I-4	80	90
I-5	80	80
I-7	80	90
I-10	80	80

Tabelle B2: Nachauflaufwirkung gegen *Amaranthus retroflexus* (AMARE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	AMARE
I-1	80	100
I-2	80	100
I-3	80	90
I-4	80	100
I-5	80	100
I-7	80	80
I-8	80	100
I-14	80	100
I-41	80	90
I-45	80	80
I-277	80	80
I-292	80	90
I-293	80	100
I-294	80	80

5

Tabelle B3: Nachauflaufwirkung gegen *Polygonum convolvulus* (POLCO)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	POLCO
I-3	80	100
I-4	80	90
I-41	80	80
I-293	80	100
I-294	80	80

Tabelle B4: Nachaufwirkung gegen *Setaria viridis* (SETVI)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	SETVI
I-45	80	80
I-277	80	80
I-294	80	90

Tabelle B5: Nachaufwirkung gegen *Veronica persica* (VERPE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VERPE
I-3	80	80
I-4	80	90
I-41	80	90
I-292	80	90

5 Tabelle B6: Nachaufwirkung gegen *Viola tricolor* (VIOTR)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VIOTR
I-1	80	90
I-2	80	90
I-3	80	100
I-4	80	80
I-5	80	80
I-7	80	90
I-8	80	90
I-10	80	100
I-14	80	100
I-43	80	80
I-292	80	90

Wie die Ergebnisse der Tabellen B1-B6 beispielhaft zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen Nr. I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-7, I-8, I-10, I-14, I-41, I-43, I-45, I-277, I-292, I-293 und I-294 bei Behandlung im Nachaufwurf eine sehr gute herbizide Wirksamkeit gegen die Schadpflanzen

- 10 *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Polygonum convolvulus* (POLCO), *Setaria viridis* (SETVI), *Veronica persica* (VERPE) und *Viola tricolor* (VIOTR) bei einer Aufwandmenge von 80 g Aktivsubstanz pro Hektar auf.

C. Herbizide Wirkung im Voraufbau bei 320 g/ha

- Samen von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen wurden in Kunststofftöpfen, in sandigem Lehmboden, ausgelegt (Doppelaussaaten mit jeweils eine Spezies mono- bzw. dikotyler Unkrautpflanzen pro Topf) und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion, unter Zusatz von 0,5% Additiv, mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 Liter pro Hektar auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert. Nach der Behandlung wurden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Testpflanzen gehalten. Nach ca. 3 Wochen wurde die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen in Prozentwerten bonitiert.
- Beispielsweise bedeutet 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0% Wirkung = wie Kontrollpflanzen.
- In nachstehenden Tabellen C1 bis C12 sind die Wirkungen ausgewählter Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Tabelle 1 auf verschiedene Schadpflanzen und einer Aufwandmenge entsprechend 320 g/ha, die gemäß zuvor genannter Versuchsvorschrift erhalten wurden, dargestellt.

20 Tabelle C1: Voraufbauwirkung gegen *Abutilon theophrasti* (ABUTH)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ABUTH
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	100
I-11	320	90
I-12	320	90
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-46	320	90
I-178	320	100

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	ABUTH
I-179	320	100
I-200	320	90
I-201	320	90
I-245	320	90
I-277	320	100
I-278	320	100
I-292	320	90
I-294	320	100
I-295	320	100
I-296	320	100
I-297	320	90
I-299	320	90

Tabelle C2: Voraufwirkung gegen *Alopecurus myosuroides* (ALOMY)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	ALOMY
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	90
I-7	320	90
I-8	320	100
I-11	320	100
I-41	320	90
I-45	320	100

Tabelle C3: Voraufwirkung gegen *Amaranthus retroflexus* (AMARE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	AMARE
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-46	320	90
I-178	320	100
I-179	320	100
I-180	320	100
I-200	320	100
I-201	320	90
I-202	320	90
I-245	320	100
I-277	320	100
I-292	320	100
I-294	320	100
I-295	320	100
I-296	320	100
I-297	320	90
I-298	320	90
I-299	320	100

Tabelle C4: Voraufwirkung gegen *Digitaria sanguinalis* (DIGSA)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	DIGSA
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	90

Tabelle C5: Voraufwirkung gegen *Echinochloa crus-galli* (ECHCG)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ECHCG
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	90
I-6	320	100
I-7	320	100
I-10	320	100
I-41	320	90
I-43	320	90
I-45	320	100
I-178	320	100
I-179	320	100
I-200	320	90
I-277	320	100
I-278	320	100
I-294	320	100
I-295	320	90
I-296	320	90
I-299	320	90

Tabelle C6: Voraufwirkung gegen *Bassia scoparia* (KCHSC)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	KCHSC
I-1	320	90
I-2	320	90
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	90
I-8	320	100
I-10	320	90
I-11	320	90
I-14	1280	100
I-41	1280	100
I-43	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	90
I-178	1280	90
I-179	1280	90
I-201	1280	90
I-244	1280	90
I-245	1280	100
I-277	1280	100
I-278	1280	100
I-288	1280	90
I-289	1280	90
I-291	1280	90
I-292	1280	100
I-294	1280	100
I-295	1280	100
I-296	1280	100

Tabelle C7: Voraufwirkung gegen *Lolium rigidum* (LOLRI)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	LOLRI
I-1	320	90
I-2	320	90
I-10	320	90
I-294	320	100

Tabelle C8: Voraufwirkung gegen *Matricaria inodora* (MATIN)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	MATIN
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	100
I-11	320	100
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	90
I-45	320	100
I-46	320	100
I-178	320	100
I-179	320	100
I-180	320	100
I-200	320	90
I-245	320	90
I-277	320	90
I-292	320	100
I-294	320	100
I-295	320	100
I-296	320	100
I-297	320	100
I-298	320	90

Tabelle C9: Voraufwirkung gegen Poa annua (POAAN)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	POAAN
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	90
I-11	320	100
I-12	320	100
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-178	320	100
I-179	320	100
I-180	320	100
I-200	320	90
I-201	320	100
I-277	320	100
I-288	320	90
I-294	320	100
I-295	320	90
I-296	320	100
I-299	320	90

Tabelle C10: Voraufaufwirkung gegen *Setaria viridis* (SETVI)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	SETVI
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	90
I-10	320	90
I-11	320	90
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-178	320	100
I-179	320	100
I-277	320	100
I-292	320	90
I-294	320	100
I-295	320	100
I-296	320	100
I-299	320	90

Tabelle C11: Voraufaufwirkung gegen *Stellaria media* (STEME)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	STEME
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	100
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	100
I-11	320	100
I-12	320	90
I-14	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-46	320	90

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	STEME
I-178	320	100
I-179	320	100
I-180	320	100
I-200	320	100
I-201	320	90
I-202	320	100
I-245	320	100
I-277	320	100
I-278	320	100
I-288	320	90
I-289	320	90
I-292	320	100
I-294	320	100
I-295	320	100
I-296	320	100
I-297	320	100
I-298	320	100
I-299	320	100
I-300	320	90

Tabelle C12: Voraufwirkung gegen Veronica persica (VERPE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VERPE
I-1	320	100
I-2	320	100
I-3	320	100
I-5	320	90
I-6	320	100
I-7	320	100
I-8	320	100
I-10	320	100
I-11	320	100
I-41	320	100
I-43	320	100
I-45	320	100
I-178	320	100
I-179	320	90
I-244	320	90
I-277	320	100
I-278	320	100

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VERPE
I-292	320	90
I-294	320	100
I-295	320	90
I-296	320	90

Wie die Ergebnisse der Tabellen C1-C12 beispielhaft zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen Nr. I-1, I-2, I-3, I-5, I-6, I-7, I-8, I-10, I-11, I-12, I-14, I-41, I-43, I-45, I-46, I-178, I-179, I-180, I-200, I-201, I-202, I-245, I-277, I-278, I-288, I-289, I-291, I-292, I-294, I-295, I-296, I-297, I-298, I-299 und I-300 bei Behandlung im Voraufbau eine sehr gute herbizide Wirksamkeit gegen die Schädelpflanzen *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Bassia scoparia* (KCHSC), *Lolium rigidum* (LOLRI), *Matricaria inodora* (MATIN), *Poa annua* (POAAN), *Setaria viridis* (SETVI), *Stellaria media* (STEME) und *Veronica persica* (VERPE) bei einer Aufwandmenge von 320 g Aktivsubstanz pro Hektar auf.

D. Herbizide Wirkung im Voraufbau bei 80 g/ha

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut und Kulturpflanzen wurden in Kunststoff- oder organischen Pflanztopfen ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion unter Zusatz von 0,5% Additiv mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 l/ha auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert. Nach der Behandlung wurden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Testpflanzen gehalten. Nach ca. 3 Wochen wurde die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen in Prozentwerten bonitiert. Beispielsweise bedeutet 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0% Wirkung = wie Kontrollpflanzen.

In nachstehenden Tabellen D1 bis D12 sind die Wirkungen ausgewählter Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Tabelle 1 auf verschiedene Schädelpflanzen und einer Aufwandmenge entsprechend 80 g/ha, die gemäß zuvor genannter Versuchsvorschrift erhalten wurden, dargestellt.

Tabelle D1: Voraufbauwirkung gegen Abutilon theophrasti (ABUTH)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	ABUTH
I-1	80	80
I-2	80	90
I-4	80	100
I-5	80	90
I-7	80	100
I-8	80	100
I-10	80	90
I-14	80	80
I-41	80	80
I-45	80	90
I-277	80	90
I-293	80	90
I-294	80	90

Tabelle D2: Voraufbauwirkung gegen Alopecurus myosuroides (ALOMY)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	ALOMY
I-1	80	90
I-2	80	80
I-4	80	90
I-5	80	90
I-7	80	100
I-8	80	90
I-41	80	80
I-277	80	80
I-292	80	80
I-293	80	90
I-294	80	90

Tabelle D3: Voraufwirkung gegen *Amaranthus retroflexus* (AMARE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	AMARE
I-1	80	100
I-2	80	100
I-3	80	100
I-4	80	100
I-5	80	100
I-7	80	100
I-8	80	100
I-10	80	90
I-14	80	100
I-41	80	100
I-43	80	100
I-45	80	100
I-277	80	100
I-292	80	100
I-293	80	100
I-294	80	100

Tabelle D4: Voraufwirkung gegen *Avena fatua* (AVEFA)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	AVEFA
I-4	80	80

5 Tabelle D5: Voraufwirkung gegen *Digitaria sanguinalis* (DIGSA)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	DIGSA
I-3	80	100
I-4	80	100
I-10	80	90

Tabelle D6: Voraufwirkung gegen *Matricaria inodora* (MATIN)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	MATIN
I-1	80	100
I-3	80	100
I-4	80	90

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	MATIN
I-5	80	90
I-7	80	90
I-10	80	90
I-41	80	80
I-43	80	90
I-277	80	100
I-293	80	100
I-294	80	100

Tabelle D7: Voraufwirkung gegen *Ipomoea purpurea* (PHBPU)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	PHBPU
I-4	80	80
I-277	80	100
I-294	80	100

Tabelle D8: Voraufwirkung gegen *Polygonum convolvulus* (POLCO)

Beispiel- nummer	Dosierung [g/ha]	POLCO
I-1	80	90
I-2	80	80
I-3	80	90
I-4	80	90
I-5	80	90
I-7	80	90
I-8	80	90
I-10	80	90
I-41	80	90
I-45	80	80
I-277	80	100
I-293	80	80
I-294	80	90

Tabelle D9: Voraufwirkung gegen *Setaria viridis* (SETVI)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	SETVI
I-1	80	80
I-4	80	100
I-5	80	90
I-7	80	100
I-8	80	100
I-41	80	80
I-43	80	90
I-45	80	90
I-277	80	100
I-293	80	100
I-294	80	100

Tabelle D10: Voraufwirkung gegen *Veronica persica* (VERPE)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VERPE
I-1	80	90
I-2	80	90
I-3	80	80
I-4	80	100
I-5	80	90
I-7	80	90
I-8	80	80
I-41	80	80
I-43	80	90
I-45	80	80
I-277	80	80
I-292	80	90
I-293	80	80

5 Tabelle D11: Voraufwirkung gegen *Viola tricolor* (VIOTR)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VIOTR
I-1	80	90
I-2	80	90
I-3	80	100
I-4	80	100
I-5	80	90

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	VIOTR
I-7	80	100
I-8	80	90
I-10	80	100
I-14	80	100
I-41	80	80
I-43	80	80
I-45	80	90
I-277	80	100
I-292	80	90
I-293	80	90
I-294	80	100

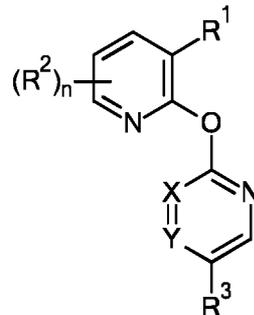
Tabelle D12: Voraufwirkung gegen *Echinochloa crus-galli* (ECHCG)

Beispielnummer	Dosierung [g/ha]	ECHCG
I-45	80	80
I-277	80	100
I-294	80	90

- 5 Wie die Ergebnisse der Tabellen D1-D12 beispielhaft zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen Nr. I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-7, I-8, I-10, I-14, I-41, I-43, I-45, I-277, I-292, I-293 und I-294 bei Behandlung im Voraufbau eine sehr gute herbizide Wirksamkeit gegen die Schädipflanzen *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Avena fatua* (AVEFA), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Matricaria inodora* (MATIN), *Ipomoea purpurea* (PHBPU), *Polygonum convolvulus* (POLCO), *Setaria viridis* (SETVI), *Veronica persica* (VERPE) und *Viola tricolor* (VIOTR) bei einer Aufwandmenge von 80 g Aktivsubstanz pro Hektar auf.
- 10

Patentansprüche

1. Substituierte Heteroaryloxypyridine der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze



(I)

5 worin

R¹ für ein gegebenenfalls substituiertes 5-Ring-Heteroaryl steht, das optional mit bis zu 3 Substituenten, unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe R⁴, substituiert ist,

10 R² unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, Formamid, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Haloalkenyl, (C₂-C₄)-Haloalkinyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkenyloxy, (C₁-C₄)-Alkinyloxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₃-C₆)-Cycloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylcarbonyl, Carboxyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₂-C₆)-Dialkylaminocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonylamino, (C₂-C₆)-Cycloalkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonylamino, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonylamino, (C₂-C₆)-Dialkylaminocarbonylamino, Carboxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminosulfonyl, (C₂-C₆)-Dialkylaminosulfonyl oder (C₃-C₆)-Trialkylsilyl steht,

n ist gleich 0, 1, 2, oder 3,

30

R³ für Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Haloalkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxycarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxythiocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₆)-cycloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkyoxy-(C₁-C₄)-alkyl steht,

X für N oder CR⁵ steht,

Y für N oder CH steht,

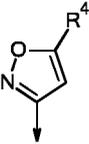
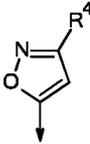
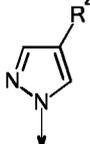
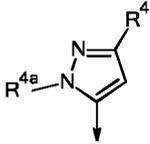
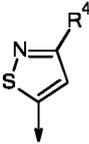
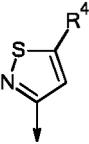
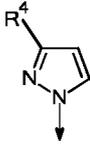
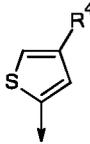
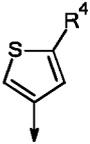
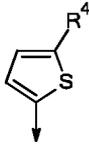
und

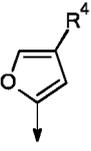
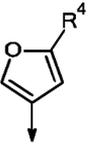
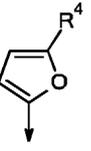
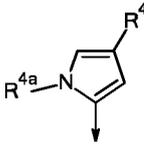
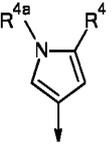
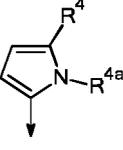
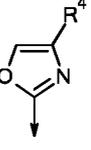
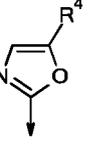
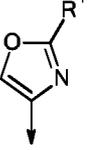
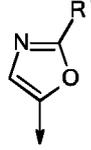
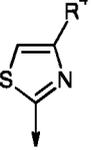
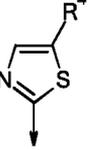
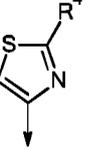
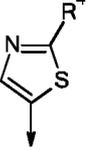
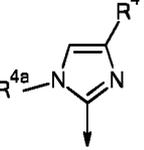
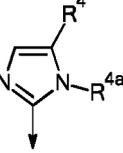
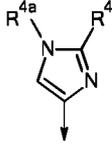
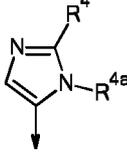
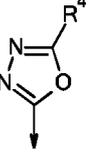
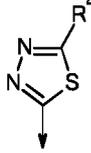
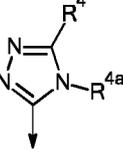
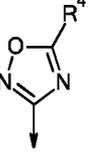
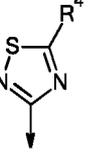
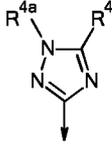
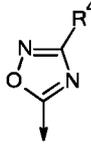
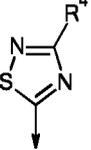
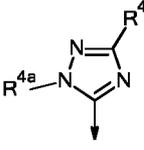
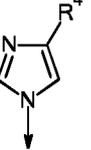
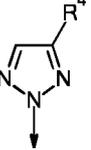
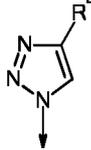
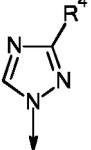
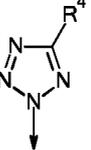
R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder Cyano steht,

ausgenommen Verbindungen, in denen R¹ für ein unsubstituiertes oder substituiertes 3-Pyrazol steht.

2. Verbindung der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1 oder deren Salze, worin

R¹ für die Gruppen R¹-1 bis R¹-42 steht:

				
R ¹ -1	R ¹ -2	R ¹ -3	R ¹ -4	R ¹ -5
				
R ¹ -6	R ¹ -7	R ¹ -8	R ¹ -9	R ¹ -10

				
R ¹ -11	R ¹ -12	R ¹ -13	R ¹ -14	R ¹ -15
				
R ¹ -16	R ¹ -17	R ¹ -18	R ¹ -19	R ¹ -20
				
R ¹ -21	R ¹ -22	R ¹ -23	R ¹ -24	R ¹ -25
				
R ¹ -26	R ¹ -27	R ¹ -28	R ¹ -29	R ¹ -30
				
R ¹ -31	R ¹ -32	R ¹ -33	R ¹ -34	R ¹ -35
				
R ¹ -36	R ¹ -37	R ¹ -38	R ¹ -39	R ¹ -40
				
R ¹ -41	R ¹ -42			

R² unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, Formamid, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl,

(C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Haloalkenyl, (C₂-C₄)-Haloalkinyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkenyloxy, (C₁-C₄)-Alkinyloxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₃-C₆)-Cycloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylcarbonyl, Carboxyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₂-C₆)-Dialkylaminocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonylamino, (C₂-C₆)-Cycloalkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonylamino oder (C₃-C₆)-Trialkylsilyl steht,

n ist gleich 0, 1, oder 2,

R³ für Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Haloalkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Cyano, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxythiocarbonyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₆)-cycloalkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl steht,

R^{4a} für Wasserstoff oder (C₁-C₂)-Alkyl steht,

X für N oder CR⁵ steht,

25

Y für N oder CH steht,

und

30 R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder Cyano steht.

3. Verbindung der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1 oder deren Salze, worin

35 R¹ für die Gruppen R¹-1 bis R¹-3 gemäß Anspruch 2 steht,

R² unabhängig voneinander für Chlor, Brom, Cyano oder Methyl steht,

n ist gleich 1 oder 2,

R³ für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro oder Trifluormethyl steht,

5

R⁴ für Wasserstoff, Chlor, Brom, Jod, Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlorfluormethyl, Difluorchlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Difluorbrommethyl, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, (1-Methyl)cyclopropyl oder Methoxymethyl steht,

10

X für N oder CR⁵ steht,

Y für N oder CH steht,

und

15

R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Cyano steht.

4. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen herbizid wirksamen Gehalt an mindestens einer Verbindung der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3.

20

5. Herbizide Mittel nach Anspruch 4 in Mischung mit Formulierungshilfsmitteln.

6. Herbizide Mittel nach Anspruch 4 oder 5 enthaltend mindestens einen weiteren pestizid wirksamen Stoff aus der Gruppe Insektizide, Akarizide, Herbizide, Fungizide, Safener und Wachstumsregulatoren.

25

7. Herbizide Mittel nach Anspruch 6 enthaltend einen Safener.

8. Herbizide Mittel nach Anspruch 7 enthaltend Cyprosulfamid, Cloquintocet-mexyl, Mefenpyr-diethyl oder Isoxadifen-ethyl.

30

9. Herbizide Mittel nach einem der Ansprüche 4 bis 8 enthaltend ein weiteres Herbizid.

10. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3 oder eines herbiziden Mittels nach einem der Ansprüche 4 bis 9 auf die Pflanzen oder auf den Ort des unerwünschten Pflanzenwachstums appliziert.

35

11. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3 oder von herbiziden Mitteln nach einem der Ansprüche 4 bis 9 zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.
- 5
12. Verwendung nach Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, daß die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen in Kulturen von Nutzpflanzen eingesetzt werden.
- 10 13. Verwendung nach Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet, daß die Nutzpflanzen transgene Nutzpflanzen sind.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP2021/067667

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
<i>C07D 401/14</i> (2006.01)i; <i>C07D 413/14</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/50</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/80</i> (2006.01)i		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, BIOSIS, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2004035564 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; NEBEL KURT [CH] ET AL.) 29 April 2004 (2004-04-29) cited in the application compounds IW1 in tables 1, 2, 9-13, 16 and 17 for numbers .148 to .154, respectively; claims	1-13
Y	WO 2020094524 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG [CH]) 14 May 2020 (2020-05-14) claims; examples; table 1 (pages 43 ff.)	1-13
Y	WO 2015108779 A1 (DU PONT [US]) 23 July 2015 (2015-07-23) claims; examples; tables 1 (pages 57 ff.), A (pages 113 ff.)	1-13
Y	WO 2015089003 A1 (DU PONT [US]) 18 June 2015 (2015-06-18) claims; examples; tables 1 (pages 50 ff.), A (pages 101 ff.)	1-13
Y	WO 2016149315 A1 (DU PONT [US]) 22 September 2016 (2016-09-22) cited in the application claims; examples; tables 1, 2 (pages 43 ff.), A (pages 89 ff.)	1-13
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 08 September 2021		Date of mailing of the international search report 21 September 2021
Name and mailing address of the ISA/EP European Patent Office p.b. 5818, Patentlaan 2, 2280 HV Rijswijk Netherlands Telephone No. (+31-70)340-2040 Facsimile No. (+31-70)340-3016		Authorized officer Stroeter, Thomas Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/EP2021/067667

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
WO	2004035564	A1	29 April 2004	AU	2003274025	A1	04 May 2004
				WO	2004035564	A1	29 April 2004
WO	2020094524	A1	14 May 2020	AR	116949	A1	30 June 2021
				CN	112996780	A	18 June 2021
				EP	3877378	A1	15 September 2021
				UY	38447	A	30 June 2020
				WO	2020094524	A1	14 May 2020
WO	2015108779	A1	23 July 2015	AR	099122	A1	29 June 2016
				AU	2015206757	A1	30 June 2016
				AU	2019226283	A1	26 September 2019
				BR	112016016443	B1	28 July 2020
				CA	2934891	A1	23 July 2015
				CL	2016001789	A1	24 February 2017
				CN	105916849	A	31 August 2016
				CN	111574510	A	25 August 2020
				DK	3094631	T3	06 May 2019
				EA	201691439	A1	30 December 2016
				EP	3094631	A1	23 November 2016
				ES	2719410	T3	10 July 2019
				HU	E044404	T2	28 October 2019
				IL	246373	A	31 March 2020
				JP	6541667	B2	10 July 2019
				JP	2017504624	A	09 February 2017
				KR	20160107276	A	13 September 2016
				MD	20160095	A2	31 December 2016
				PE	20161143	A1	18 November 2016
				PL	3094631	T3	31 July 2019
				SG	11201604813Y	A	28 July 2016
				SI	3094631	T1	31 May 2019
				TR	201904712	T4	22 April 2019
				TW	201613876	A	16 April 2016
				UA	124329	C2	01 September 2021
				US	2016333000	A1	17 November 2016
				US	2019084972	A1	21 March 2019
				US	2020270238	A1	27 August 2020
				UY	35953	A	31 August 2015
				WO	2015108779	A1	23 July 2015
WO	2015089003	A1	18 June 2015	AR	098698	A1	08 June 2016
				AU	2014364097	A1	02 June 2016
				BR	112016012819	B1	17 November 2020
				CA	2932433	A1	18 June 2015
				CN	106232594	A	14 December 2016
				EP	3080102	A1	19 October 2016
				RU	2016127518	A	23 January 2018
				TW	201609710	A	16 March 2016
				US	2016340340	A1	24 November 2016
				UY	35871	A	31 July 2015
				WO	2015089003	A1	18 June 2015
WO	2016149315	A1	22 September 2016	AR	103965	A1	14 June 2017
				AU	2016233348	A1	15 June 2017

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/EP2021/067667

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
		BR 112017012197 A2	16 January 2018
		CA 2969816 A1	22 September 2016
		CN 107250134 A	13 October 2017
		EP 3271350 A1	24 January 2018
		RU 2017134351 A	04 April 2019
		US 2018020664 A1	25 January 2018
		WO 2016149315 A1	22 September 2016
<hr/>			

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D401/14 C07D413/14 A01N43/50 A01N43/80 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, BIOSIS, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2004/035564 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; NEBEL KURT [CH] ET AL.) 29. April 2004 (2004-04-29) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen IW1 der Tabellen 1, 2, 9-13, 16 und 17, jeweils für die Nummern .148 bis .154; Ansprüche -----	1-13
Y	WO 2020/094524 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG [CH]) 14. Mai 2020 (2020-05-14) Ansprüche; Beispiele; Tabelle 1 (Seiten 43ff.) ----- -/--	1-13
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absenddatum des internationalen Recherchenberichts	
8. September 2021	21/09/2021	
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Stroeter, Thomas	

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2015/108779 A1 (DU PONT [US]) 23. Juli 2015 (2015-07-23) Ansprüche; Beispiele; Tabellen 1 (Seiten 57ff.), A (Seiten 113ff.) -----	1-13
Y	WO 2015/089003 A1 (DU PONT [US]) 18. Juni 2015 (2015-06-18) Ansprüche; Beispiele; Tabellen 1 (Seiten 50ff.), A (Seiten 101ff.) -----	1-13
Y	WO 2016/149315 A1 (DU PONT [US]) 22. September 2016 (2016-09-22) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele; Tabellen 1, 2 (Seiten 43ff.), A (Seiten 89ff.) -----	1-13

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2021/067667

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2004035564 A1	29-04-2004	AU 2003274025 A1	04-05-2004
		WO 2004035564 A1	29-04-2004

WO 2020094524 A1	14-05-2020	AR 116949 A1	30-06-2021
		CN 112996780 A	18-06-2021
		EP 3877378 A1	15-09-2021
		UY 38447 A	30-06-2020
		WO 2020094524 A1	14-05-2020

WO 2015108779 A1	23-07-2015	AR 099122 A1	29-06-2016
		AU 2015206757 A1	30-06-2016
		AU 2019226283 A1	26-09-2019
		BR 112016016443 B1	28-07-2020
		CA 2934891 A1	23-07-2015
		CL 2016001789 A1	24-02-2017
		CN 105916849 A	31-08-2016
		CN 111574510 A	25-08-2020
		DK 3094631 T3	06-05-2019
		EA 201691439 A1	30-12-2016
		EP 3094631 A1	23-11-2016
		ES 2719410 T3	10-07-2019
		HU E044404 T2	28-10-2019
		IL 246373 A	31-03-2020
		JP 6541667 B2	10-07-2019
		JP 2017504624 A	09-02-2017
		KR 20160107276 A	13-09-2016
		MD 20160095 A2	31-12-2016
		PE 20161143 A1	18-11-2016
		PL 3094631 T3	31-07-2019
		SG 11201604813Y A	28-07-2016
		SI 3094631 T1	31-05-2019
		TR 201904712 T4	22-04-2019
		TW 201613876 A	16-04-2016
		UA 124329 C2	01-09-2021
		US 2016333000 A1	17-11-2016
		US 2019084972 A1	21-03-2019
US 2020270238 A1	27-08-2020		
UY 35953 A	31-08-2015		
WO 2015108779 A1	23-07-2015		

WO 2015089003 A1	18-06-2015	AR 098698 A1	08-06-2016
		AU 2014364097 A1	02-06-2016
		BR 112016012819 B1	17-11-2020
		CA 2932433 A1	18-06-2015
		CN 106232594 A	14-12-2016
		EP 3080102 A1	19-10-2016
		RU 2016127518 A	23-01-2018
		TW 201609710 A	16-03-2016
		US 2016340340 A1	24-11-2016
		UY 35871 A	31-07-2015
WO 2015089003 A1	18-06-2015		

WO 2016149315 A1	22-09-2016	AR 103965 A1	14-06-2017
		AU 2016233348 A1	15-06-2017
		BR 112017012197 A2	16-01-2018
		CA 2969816 A1	22-09-2016
		CN 107250134 A	13-10-2017
EP 3271350 A1	24-01-2018		

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2021/067667

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
		RU 2017134351 A	04-04-2019
		US 2018020664 A1	25-01-2018
		WO 2016149315 A1	22-09-2016
