

(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  
8. Juli 2010 (08.07.2010)

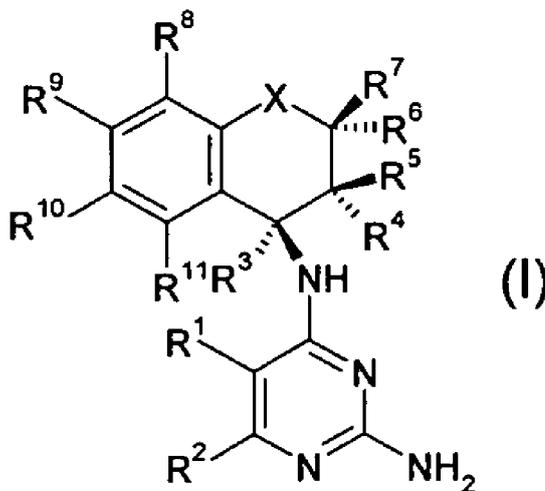
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2010/076009 A1**

- (51) **Internationale Patentklassifikation:**  
C07D 239/48 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)  
C07D 239/50 (2006.01) A01N 43/54 (2006.01)
- (21) **Internationales Aktenzeichen:** PCT/EP2009/009287
- (22) **Internationales Anmeldedatum:**  
28. Dezember 2009 (28.12.2009)
- (25) **Einreichungssprache:** Deutsch
- (26) **Veröffentlichungssprache:** Deutsch
- (30) **Angaben zur Priorität:**  
08022522.0 30. Dezember 2008 (30.12.2008) EP
- (71) **Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US):** BAYER CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim (DE).
- (72) **Erfinder; und**
- (75) **Erfinder/Anmelder (nur für US):** MINN, Klemens [DE/DE]; Rossertstrasse 61, 65795 Hattersheim (DE). DIETRICH, Hansjörg [DE/DE]; Bonifatiusstrasse 1b, 65835 Liederbach am Taunus (DE). DITTGEN, Jan [DE/DE]; Burgstrasse 26, 60316 Frankfurt (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Am Burggraben 7a, 657Eschborn (DE). HÄUSER-HAHN, Isolde [DE/DE]; Dünfelder Strasse 22, 51375 Leverkusen (DE). ROSINGER, Christopher, Hugh [GB/DE]; Am Hochfeld 33, 65719 Hofheim (DE).
- (74) **Gemeinsamer Vertreter:** BAYER CROPSCIENCE AG; Patent- und Lizenzabteilung, Industriepark Höchst, Gebäude K801, 65936 Frankfurt (DE).
- (81) **Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart):** AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) **Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart):** ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title:** PYRIMIDINE DERIVATIVES AND THE USE THEREOF FOR COMBATING UNDESIREED PLANT GROWTH

(54) **Bezeichnung :** PYRIMIDINDERIVATE UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG UNERWÜNSCHTEN PFLANZENWACHSTUMS



(57) **Abstract:** The invention relates to compounds of the common formula (I) and to the use thereof in the field of plant protection.

(57) **Zusammenfassung:** Pyrimidinderivate und ihre Verwendung zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwachstums Beschrieben werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Verwendung im Bereich des Pflanzenschutzes.



WO 2010/076009 A1

**Veröffentlicht:**

- *mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)*

Pyrimidinderivate und ihre Verwendung zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwachstums

## Beschreibung

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

Speziell betrifft sie 2-Aminopyrimidine, Verfahren zu deren Herstellung sowie deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadpflanzen.

Aus dem Stand der Technik sind Pyrimidine bekannt, welche eine herbizide Wirkung aufweisen. So beschreibt beispielsweise die EP 0 523 533 A1 substituierte 4-Aminopyrimidine und deren Anwendung im Bereich des Pflanzenschutzes. WO 2008/043031 offenbart (R)-6-Chlor-N<sup>4</sup>-(8-fluorchroman-4-yl)pyrimidin-2,4,5-triamin als Vorstufe zur Herstellung von pharmakologisch wirksamen Purinen.

Die Anwendung der Derivate dieses Typs als selektive Herbizide zur Schadpflanzenbekämpfung oder als Pflanzenwachstumsregulatoren in verschiedenen Nutzpflanzenkulturen erfordert jedoch häufig eine unzeitgemäße Aufwandmenge oder führt zu unerwünschten Schädigungen der Nutzpflanzen. Zudem ist die Anwendung der Wirkstoffe in vielen Fällen wegen verhältnismäßig hoher Herstellkosten unwirtschaftlich.

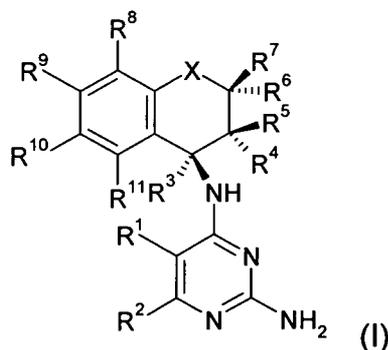
Es ist deshalb wünschenswert, alternative chemische Wirkstoffe auf Basis von Pyrimidin-Derivaten bereitzustellen, die als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können und mit welchen bestimmte Vorteile im Vergleich zu aus dem Stand der Technik bekannten Systemen verbunden sind.

Damit ergibt sich im Allgemeinen als Aufgabe der vorliegenden Erfindung, alternative Pyrimidin-Derivate bereitzustellen, welche als Herbizide oder Pflanzenwachstumsre-

gulatoren, insbesondere mit einer zufriedenstellenden herbiziden Wirkung gegen Schadpflanzen, mit einem breiten Spektrum gegenüber Schadpflanzen und/oder mit einer hohen Selektivität in Nutzpflanzenkulturen, eingesetzt werden können. Diese Pyrimidin-Derivate sollten dabei vorzugsweise ein besseres Eigenschaftsprofil, insbesondere eine bessere herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen, ein breiteres Spektrum gegenüber Schadpflanzen und/oder eine höhere Selektivität in Nutzpflanzenkulturen, als die aus dem Stand der Technik bekannten Pyrimidin-Derivate zeigen.

10 Erfindungsgemäß wurden nun neue Pyrimidine gefunden, welche vorteilhaft als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können. Die Verbindungen dieser Reihe zeichnen sich neben gutem Wirksamkeitsprofil und Kulturpflanzenverträglichkeit durch kostengünstige Herstellprozesse und Zugangsmöglichkeiten aus, da die erfindungsgemäßen Substanzen aus preiswerten und gut zugänglichen Vorstufen hergestellt werden können und daher auf die Verwendung teurer und schwer zugänglicher Zwischenprodukte verzichtet werden kann.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel (I) und deren Salze



in welchen

25 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup>, unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, Nitro, Amino, C(O)OH, C(O)NH<sub>2</sub>;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyloxycarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenyloxycarbonyl;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkinyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyloxycarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkinyloxycarbonyl;
- Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl, Mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl; Phenylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl;
- (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylcarbonyl und (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxycarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und/oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyloxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxycarbonyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxycarbonyloxy;
- Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino, Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino, ((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkanoyl)-amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkanoyl)-amino, Aminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl;
- Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino-carbonyl, Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino-carbonyl, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino-carbonyl, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino-carbonyl, ((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino-carbonyl, N-

- ((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkanoyl)-amino-carbonyl, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkanoyl)-amino-carbonyl;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-carbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy;
  - 5 - (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, welches gegebenenfalls am Cycloalkylrest durch (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxy-carbonyloxy;
  - (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-oxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-oxy-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy-carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxy-carbonyloxy;
  - Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy Cyano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, Cyano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl;
  - 30 - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

- Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthiocarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthiocarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyloxy, (C<sub>4</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylsulfonyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylthio, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio;
- 5
- 10
- 15 - die Reste R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen eine (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylengruppe bilden, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten können, wobei die (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können;
- 20
- R<sup>3</sup> ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl;
- 25 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup>, jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy; oder zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an welchem sie gebunden sind, einen drei- bis siebengliedrigen Ring bilden;
- 30 R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup>, jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylcarbonyl und (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxycarbonyl; oder die Reste R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> zusammen eine (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe bilden, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten können, wobei die (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können,

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup>, unabhängig voneinander, jeweils ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyloxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Di-Alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkynyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyloxycarbonyl und (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkynyloxycarbonyl; und

X für eine Bindung, CH<sub>2</sub>, O, S, Carbonyl, NH, CR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> und NR<sub>14</sub> steht,

R<sup>12</sup> R<sup>13</sup> jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl,

R<sup>14</sup> ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl,

- a) mit der Maßgabe, dass mindestens ein Rest von R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> oder R<sup>11</sup> ungleich Wasserstoff ist, wenn R<sup>2</sup> gleich CF<sub>3</sub> ist,  
b) R<sup>2</sup> nicht Chlor bedeutet, wenn R<sup>1</sup> für NH<sub>2</sub> steht.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den Verbindungen gemäß EP 0 523 533 A1 dahingehend, dass es sich um bicyclisch substituierte 4-Aminopyrimidin-2-amine handelt.

Erfindungsgemäß wurde herausgefunden, dass diese Verbindungen ein gutes Wirk-  
samkeitsprofil und Kulturpflanzenverträglichkeit aufweisen.

Im Folgenden werden nunmehr zunächst bevorzugte, besonders bevorzugte und  
5 ganz besonders bevorzugte Bedeutungen für die einzelnen Substituenten  
beschrieben.

Eine erste Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der  
allgemeinen Formel (I), in welchen

10

R<sup>1</sup> bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halo-  
gen, Cyano, C(=O)NH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
Haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cyclopropyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Thioalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-  
Alkinyl, Mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino und Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
15 alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkinyl;

15

R<sup>1</sup> besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus  
Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Trimethylsilylethynyl,  
Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, n-Heptyl,  
20 Cyclopropyl, Cyclobutyl, Acetyl, Ethinyl, Amino, Dimethylamino,  
Trifluormethyl, Difluormethyl, Monofluormethyl, Methoxy, Ethoxy und  
Methoxymethyl; und

20

R<sup>1</sup> ganz besonders bevorzugt Cyano, Acetyl oder Trifluormethyl ist.

25

Eine zweite Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der  
allgemeinen Formel (I), in welchen

R<sup>2</sup> bevorzugt ausgewählt wird aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff,  
Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylphenyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl, welches am Arylrest durch (C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Haloalkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; C<sub>6</sub>-Aryl-  
30 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

30

Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, welches am Cycloalkylrest durch (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Haloaryl und/oder Halogen substituiert sein kann; 1-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcyclopropyl, 1-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-C<sub>6</sub>-aryl)-cyclopropyl, 1-(Monohalogenphenyl)-cyclopropyl, 1-(Dihalogenphenyl)-cyclopropyl, Mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Thioalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy und Amino;

5  
10  
15  
R<sup>2</sup> besonders bevorzugt ausgewählt wird aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Chlor, Phenyl, 2-Methylphenyl, 3-Trifluormethylphenyl, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, n-Heptyl, Trifluormethyl, 1-Methylcyclopropyl, 1-(p-Xylyl)-cyclopropyl, 1-(2,4-Dichlorphenyl)-cyclopropyl, Amino, Dimethylamino, Trifluormethyl, Difluormethyl, Monofluormethyl, CHFCH<sub>3</sub>, CF(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CHF(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>), 1-Fluorcyclopropyl, Cyclopentyl, Methoxy, Ethoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Thiomethyl, Methylthio und Methoxy;

R<sup>2</sup> ganz besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Difluormethyl ist.

20 Eine dritte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

25 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bevorzugt zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an welche sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, welcher durch ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus Sauerstoff und Schwefel, unterbrochen sein kann;

30 besonders bevorzugt zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an welche sie gebunden sind, einen fünfgliedrigen Ring bilden, welcher durch ein Heteroatom, ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus Sauerstoff und Schwefel, unterbrochen sein kann; und

ganz besonders bevorzugt -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- oder -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>- sind.

Eine vierte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

5  $R^3$  bevorzugt Wasserstoff oder  $(C_1-C_6)$ -Alkyl ist; und

$R^3$  besonders bevorzugt Wasserstoff ist.

10 Eine fünfte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

$R^4$  und  $R^5$ , jeweils unabhängig voneinander, bevorzugt ausgewählt werden aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl, Hydroxy, Cyclopropyl und  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy;

15

$R^4$  und  $R^5$ , jeweils unabhängig voneinander, besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, Cyclopropyl, Hydroxy und Methoxy; und

20  $R^4$  und  $R^5$ , jeweils unabhängig voneinander, ganz besonders bevorzugt Methyl, Ethyl oder Wasserstoff sind.

In dieser fünften Ausführungsform ist speziell bevorzugt, wenn mindestens einer der Reste  $R^4$  bzw.  $R^5$  Wasserstoff ist. Weiter bevorzugt ist, wenn mindestens einer der  
25 Reste  $R^4$  bzw.  $R^5$  Wasserstoff und der andere Rest  $R^4$  bzw.  $R^5$  ungleich Wasserstoff, insbesondere  $(C_1-C_6)$ -Alkyl ist.

In dieser fünften Ausführungsform ist ganz speziell bevorzugt, wenn einer der Reste  $R^4$  bzw.  $R^5$  Wasserstoff und der andere Rest von  $R^4$  bzw.  $R^5$  Methyl ist.

30

Eine sechste Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

- 5 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> bevorzugt zusammen eine (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe bilden, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten können, wobei die (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können; und
- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> besonders bevorzugt -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- oder -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- sind.
- 10 Eine siebte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen
- R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup>, unabhängig voneinander, bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl;
- 15 R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup>, unabhängig voneinander, besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Methyl und Phenyl; und
- R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> ganz besonders bevorzugt Wasserstoff sind.
- 20 Eine achte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen
- R<sup>8</sup> bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl oder Halogen;
- 25 R<sup>8</sup> besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Methyl oder Fluor; und
- 30 R<sup>8</sup> ganz besonders bevorzugt Wasserstoff ist.

Eine neunte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

- 5  $R^9$  bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- $R^9$  besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und Methyl; und
- 10  $R^9$  ganz besonders bevorzugt Wasserstoff ist.

Eine zehnte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

- 15  $R^{10}$  bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, Halogen, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkinyl; Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-carbonyl und Aminocarbonyl;
- 20  $R^{10}$  besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Methyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, tert.-Butyl, Dimethylamino, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Ethenyl, Ethinyl, Methylethinyl, Ethylethinyl, MeOCH<sub>2</sub>C≡C-, Cyano, COOMe und CONH<sub>2</sub>; und
- 25  $R^{10}$  ganz besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl ist.

Eine elfte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

- 30  $R^{11}$  bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R<sup>11</sup> besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und Methyl; und

R<sup>11</sup> ganz besonders bevorzugt Wasserstoff ist.

5

Eine zwölfte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

10 X bevorzugt ausgewählt wird aus der Gruppe, bestehend aus CH<sub>2</sub>, O, NH, einer chemischen Bindung und S; und

X besonders bevorzugt ausgewählt wird aus der Gruppe, bestehend aus CH<sub>2</sub> und O und einer chemischen Bindung.

15 Im Rahmen der vorliegenden Erfindung ist es möglich, die einzelnen bevorzugten, besonders bevorzugten und ganz besonders bevorzugten Bedeutungen für die Substituenten R<sup>1</sup> bis R<sup>11</sup> und X beliebig miteinander zu kombinieren. Das heißt, dass Verbindungen der allgemeinen Formel (I) von der vorliegenden Erfindung umfasst sind, in welchen beispielsweise der Substituent R<sup>1</sup> eine bevorzugte Bedeutung  
20 aufweist und die Substituenten R<sup>2</sup> bis R<sup>11</sup> die allgemeine Bedeutung aufweisen oder aber der Substituent R<sup>2</sup> eine bevorzugte Bedeutung aufweist, der Substituent R<sup>3</sup> eine besonders bevorzugte Bedeutung aufweist und die übrigen Substituenten eine allgemeine Bedeutung aufweisen.

25 Im Rahmen der vorliegenden Erfindung sind von der Verbindung der allgemeinen Formel (I) auch Verbindungen umfasst, die durch a) Protonierung, b) Alkylierung oder c) Oxidation an einem Stickstoffatom quaterniert sind.

Die Verbindungen der Formel (I) können Salze bilden.

30

Salzbildung kann durch Einwirkung einer Base auf solche Verbindungen der Formel (I) erfolgen, die ein acides Wasserstoffatom tragen, z.B. im Falle dass R<sup>1</sup> eine COOH-Gruppe oder eine Sulfonamid-Gruppe -NHSO<sub>2</sub>- enthält. Geeignete Basen

sind beispielsweise organische Amine, wie Trialkylamine, Morpholin, Piperidin oder 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 acide Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird, beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze, Salze mit organischen Aminen oder quartäre (quaternäre) Ammoniumsalze, zum Beispiel mit Kationen der Formel  $[NRR'R''R''']^+$ , worin R bis R''' jeweils unabhängig voneinander einen organischen Rest, insbesondere Alkyl, Aryl, Aralkyl oder Alkylaryl darstellen. Infrage kommen auch Alkylsulfonium- und Alkylsulfoxoniumsalze, wie (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Trialkylsulfonium- und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Trialkylsulfoxoniumsalze.

Die Verbindungen der Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise Mineralsäuren, wie beispielsweise HCl, HBr, H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> oder HNO<sub>3</sub>, 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, 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 oder Carbonsäuren, vorliegen, können innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie Aminogruppen bilden.

Im Folgenden werden die Verbindungen der Formel (I) und ihre Salze auch kurz als erfindungsgemäß verwendete oder erfindungsgemäße "Verbindungen (I)" bezeichnet.

In der allgemeinen Formel (I) und allen übrigen Formeln in der vorliegenden Erfindung können die Reste Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino, Alkylthio,

Haloalkylthio, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen 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 den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste; wobei mindestens eine Doppelbindung bzw. Dreifachbindung, vorzugsweise eine Doppelbindung bzw. Dreifachbindung enthalten ist. Alkenyl bedeutet z.B. Vinyl, Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl und 1-Methyl-but-2-en-1-yl; Alkinyl bedeutet z.B. Ethinyl, Propargyl, But-2-in-1-yl, But-3-in-1-yl und 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Cycloalkyl-Gruppen sind z. B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl. Die Cycloalkyl Gruppen können in bi- oder tri-cyclischer Form vorkommen.

Wenn Haloalkylgruppen und Haloalkylreste von Haloalkoxy, Haloalkylthio, Haloalkenyl, Haloalkinyl u.a. angegeben sind, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 6 C-Atomen oder 2 bis 6, insbesondere 1 bis 4 C-Atomen oder bevorzugt 2 bis 4 C-Atomen, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt. Beispiele sind Difluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Trifluorallyl, 1-Chlorprop-1-yl-3-yl.

Alkylen-Gruppen sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 10 C-Atomen, insbesondere 1 bis 6 C-Atomen oder bevorzugt 2 bis 4 C-Atomen, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im

Kohlenstoffgerüst, die jeweils geradkettig oder verzweigt sein können. Beispiele sind Methylen, Ethylen, n- und i- Propylen und n-, s-, i-, t-Butylen.

5 Hydroxyalkylgruppen sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 6 C-Atomen, insbesondere 1 bis 4 C-Atomen, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Resten im Kohlenstoffgerüst, die jeweils geradkettig oder verzweigt sein können. Beispiele hierzu sind 1,2-Dihydroxyethyl und 3-Hydroxypropyl.

10 Halogen bedeutet Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere durch Fluor und/oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl), Perhaloalkyl,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CF}_3\text{CF}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{FCHCl}$ ,  $\text{CCl}_3$ ,  $\text{CHCl}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ; Haloalkoxy ist z.B.  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  
15  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ ,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  und  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ; entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierte Reste.

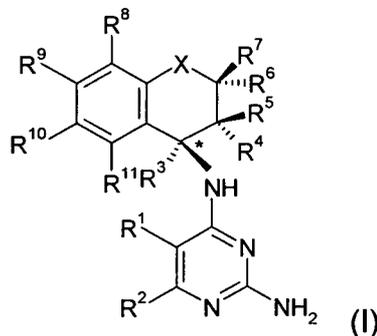
Aryl bedeutet ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl oder Naphthyl, vorzugsweise Phenyl.

20 Vor allem aus den Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität und/oder besseren Herstellbarkeit sind erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren agrochemischen Salze oder quartären N-Derivate von besonderem Interesse, worin einzelne Reste eine der bereits genannten oder im  
25 Folgenden genannten bevorzugten Bedeutungen haben, oder insbesondere solche, worin eine oder mehrere der bereits genannten oder im folgenden genannten bevorzugten Bedeutungen kombiniert auftreten.

30 Die oben angeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der allgemeinen Formel (I) als auch entsprechend für die die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- und Zwischen-

produkte. Diese Restdefinitionen können untereinander, als auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen vertauscht werden.

- Die vorliegenden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weisen ein chirales Kohlenstoffatom auf, welches in der unten dargestellten Struktur durch die Kennzeichnung (\*) verdeutlicht ist:



- 10 Gemäß den Regeln nach Cahn, Ingold und Prelog (CIP-Regeln) kann dieses Kohlenstoffatom sowohl eine (R)- als auch eine (S)-Konfiguration aufweisen.

Von der vorliegenden Erfindung werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) sowohl mit (S)- als auch mit (R)-Konfiguration erfasst, d.h., dass die vorliegende Erfindung die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erfasst, in welchen das betreffende Kohlenstoffatom

- (1) eine (R)-Konfiguration; oder
- 20 (2) eine (S)-Konfiguration

aufweist.

Darüber hinaus werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung auch

- 25 (3) beliebige Mischungen von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), welche eine (R)-Konfiguration (Verbindungen der allgemeinen Formel (I-

(R)) aufweisen, mit Verbindungen der allgemeinen Formel (I), welche eine (S)-Konfiguration (Verbindungen der allgemeinen Formel (I-(S)) aufweisen,

5 erfasst, wobei eine racemische Mischung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) mit (R)- und (S)-Konfiguration von der vorliegenden Erfindung ebenfalls umfasst ist.

Allerdings sind im Rahmen der vorliegenden Erfindung insbesondere Verbindungen  
10 der allgemeinen Formel (I) mit (R)-Konfiguration mit einer Selektivität von 60 bis 100%, vorzugsweise 80 bis 100%, insbesondere 90 bis 100%, ganz besonders 95 bis 100%, bevorzugt, wobei die jeweilige (R)-Verbindung mit einer Enantioselektivität von jeweils mehr als 50% ee, vorzugsweise 60 bis 100% ee, insbesondere 80 bis 100% ee, ganz besonders 90 bis 100% ee, meist bevorzugt 95 bis 100% ee,  
15 bezogen auf den Gesamtgehalt an betreffender (R)-Verbindung vorliegt.

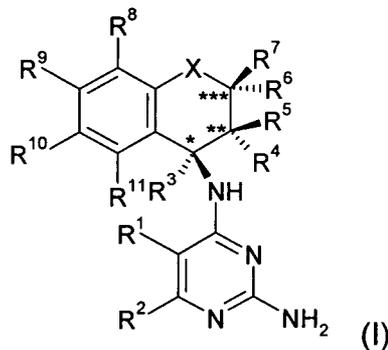
Daher betrifft die vorliegende Erfindung insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen die stereochemische Konfiguration an dem mit (\*) gekennzeichnet Kohlenstoffatom mit einer stereochemischen Reinheit von 60 bis  
20 100 % (R), vorzugsweise 80 bis 100 % (R), insbesondere 90 bis 100 % (R), ganz besonders 95 bis 100 % (R), vorliegt.

Unter Berücksichtigung der Regel nach Cahn, Ingold und Prelog kann es an dem mit (\*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom auch zu einer Situation kommen, in welcher  
25 aufgrund der Priorität der jeweiligen Substituenten die (S)-Konfiguration am mit (\*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom bevorzugt ist. Dieses ist beispielweise dann der Fall, wenn die Reste R<sup>4</sup> und/oder R<sup>5</sup> einem C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyrest entsprechen.

Daher sind im Rahmen der vorliegenden Erfindung insbesondere Verbindungen der  
30 allgemeinen Formel (I), die in ihrer räumlichen Anordnung denjenigen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) mit R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> = Wasserstoff mit (R)-Konfiguration entsprechen, mit einer Selektivität von 60 bis 100 %, vorzugsweise 80 bis 100 %,

insbesondere 90 bis 100 %, ganz besonders 95 bis 100 %, bevorzugt, wobei die jeweilige (R)-analoge-Verbindung mit einer Enantioselektivität von jeweils mehr als 50 % ee, vorzugsweise 60 bis 100 % ee, insbesondere 80 bis 100 % ee, ganz besonders 90 bis 100 % ee, meist bevorzugt 95 bis 100 % ee, bezogen auf den Gesamtgehalt an betreffender (R)-analogen-Verbindung, vorliegt. Daher betrifft die vorliegende Erfindung insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen die stereochemische Konfiguration an dem mit (\*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom mit einer stereochemischen Reinheit von 60 bis 100 % (R, bzw. analog-R), vorzugsweise 80 bis 100 % (R, bzw. analog-R), insbesondere 90 bis 100 % (R, bzw. analog-R), ganz besonders 95 bis 100 % (R, bzw. analog-R), vorliegt.

Insbesondere können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) noch weitere Chiralitätszentren an den mit (\*\*) und (\*\*\*) gekennzeichneten Kohlenstoffatomen aufweisen:



Im Rahmen der vorliegenden Erfindung sind beliebige stereochemische Konfigurationen an den mit (\*), (\*\*) und (\*\*\*) gekennzeichneten Kohlenstoffatomen möglich:

Konfiguration Kohlenstoffatom (*)	Konfiguration Kohlenstoffatom (**)	Konfiguration Kohlenstoffatom (***)
R	R	R
R	R	S
R	S	R
S	R	R
R	S	S
S	R	S
S	S	R
S	S	S

Darüber hinaus können, je nach Wahl der jeweiligen Reste, weitere Stereoelemente in den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorliegen.

Sind beispielsweise eine oder mehrere Alkenylgruppen vorhanden, so können

5 Diastereomere (Z- und E-Isomere) auftreten.

Sind beispielsweise ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome vorhanden, so können Enantiomere und Diastereomere auftreten.

10 Entsprechende Stereoisomere lassen sich aus den bei der Herstellung anfallenden Gemischen nach üblichen Trennmethoden, beispielsweise durch chromatographische Trennverfahren, erhalten. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft somit auch alle

15 Stereoisomeren, die von der allgemeinen Formel (I) umfaßt werden, jedoch nicht mit ihrer spezifischen Stereoform angegeben sind und deren Gemische.

Die Kombinationsmöglichkeiten der verschiedenen Substituenten der allgemeinen Formel (I) sind so zu verstehen, dass die allgemeinen Grundsätze des Aufbaus

20 chemischer Verbindungen zu beachten sind, d.h. die Formel (I) nicht Verbindungen umfasst, von denen der Fachmann weiß, dass sie chemisch nicht möglich sind.

In nachfolgender Tabelle werden spezifische Ausführungsbeispiele der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) genannt:

Tabelle

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.1.	H	Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.2.	H	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.3.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.4.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.5.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	F	H	-
1.6.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	-
1.7.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	Br	H	-
1.8.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CN	H	-
1.9.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CCH	H	-
1.10.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)NH <sub>2</sub>	H	-
1.11.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	-
1.12.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	-
1.13.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CCCH <sub>3</sub>	H	-
1.14.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	CCH	H	-
1.15.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	I	H	-
1.16.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	I	H	-
1.17.	H	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.18.	H	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.19.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.20.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.21.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.22.	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.23.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	Cl	H	-
1.24.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.25.	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.26.	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.27.	H	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.28.	H	CClF <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.29.	H	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	-
1.30.	H	CF <sub>2</sub> H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.31.	H	CF <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.32.	H	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.33.	H	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.34.	H	CF <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.35.	H	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.36.	H	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.37.	I	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.38.	Cl	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.39.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.40.	I	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.41.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.42.	H	Cl	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.43.	H	Cl	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.44.	H	Cl	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.45.	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.1.	H	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.46.	Cl	CF <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.47.	H	OCH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.48.	H	OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.49.	H	OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.50.	CN	-Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.51.	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.52.	CN	Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.53.	CN	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.54.	CN	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.55.	CN	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.56.	CF <sub>3</sub>	H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.57.	CF <sub>3</sub>	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.58.	Cl	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.59.	Cl	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.60.	Br	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.61.	Br	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.62.	H	C(=O)OCH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.63.	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.64.	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.65.	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.66.	Br	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.67.	Br	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.68.	Br	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.69.	CN	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.70.	C≡CH	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.71.	C≡CCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.72.	CN	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.73.	C≡CH	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.74.	C≡CCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.75.	C≡CH	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.76.	C(=O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.77.	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.78.	Br	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.79.	Br	CF <sub>2</sub> H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.80.	CN	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.81.	CN	CF <sub>2</sub> H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.82.	CCH	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.83.	C(=O)CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.84.	C(=O)CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.85.	CN	CFH <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.86.	Br	CFH <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.87.	Br	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.88.	Br	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	-
1.89.	CN	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.90.	C≡CH	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.91.	C≡CCH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.92.	C≡CH	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.93.	Br	CF <sub>2</sub> H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.94.	H	CN	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.95.	H	C(=O)NH <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.96.	H	C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.97.	C(=O)NH <sub>2</sub>	Cl	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.98.	C(=O)NH <sub>2</sub>	Br	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.99.	CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.100.	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.101.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.102.	Cl	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.103.	Cl	-N-Morpholin	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.104.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.105.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.106.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.107.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.108.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	-O-
1.109.	Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.110.	Cl	H	CH <sub>3</sub>	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.111.	Cl	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.112.	Br	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.113.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.114.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.115.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.116.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		F	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.117.	CN	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	rac	H	H		H	H		F	H	H	H	-O-
1.118.	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.119.	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.120.	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CCH	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.121.	Cl	OCH <sub>2</sub> CCH	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.122.	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.123.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	Cl	H	-
1.124.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	Cl	H	-
1.125.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	F	F	H	-
1.126.	H	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	-
1.127.	H	OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	-
1.128.	H	OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-
1.129.	Cl	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	H	H	-
1.130.	Cl	CF <sub>2</sub> H	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	H	H	-
1.131.	Cl	CH <sub>3</sub>	H	rac	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		H	H		H	H	H	H	-
1.132.	Br	CH <sub>3</sub>	H	rac	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		H	H		H	H	H	H	-
1.133.	CN	CH <sub>3</sub>	H	rac	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		H	H		H	H	H	H	-
1.134.	C≡CH	CH <sub>3</sub>	H	rac	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		H	H		H	H	H	H	-
1.135.	Cl	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	H		H	H	H	H	-
1.136.	Br	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	H		H	H	H	H	-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.137.	CN	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	H		H	H	H	H	-
1.138.	C≡CCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	H		H	H	H	H	-
1.139.	C≡CH	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	H		H	H	H	H	-
1.140.	C(=O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	H		H	H	H	H	-
1.141.	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.142.	OCH <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.143.	OCH <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.144.	OCH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.145.	OCH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	F	H	-O-
1.146.	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	F	H	-O-
1.147.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.148.	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.149.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.150.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.151.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	-
1.152.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	-
1.153.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.154.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	I	H	-
1.155.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CN	H	-
1.156.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CCH	H	-
1.157.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)NH <sub>2</sub>	H	-
1.158.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)OH	H	-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.159.	CH <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)CH <sub>3</sub>	H	-
1.160.	H	2F-Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.161.	H	2F,4CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.162.	CN	2,4-F-Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.163.	CN	4CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.164.	CN	4F-Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.165.	Br	4CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.166.	C≡CH	4CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.167.	Br	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.168.	CN	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.169.	C≡CH	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.170.	C(=O)CH <sub>3</sub>	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.171.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.172.	Br	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.173.	CN	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.174.	C≡CH	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.175.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.176.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.177.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.178.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.179.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.180.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.181.	C≡CH	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.182.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.183.	Br	2Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.184.	CN	2Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.185.	H	2F-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.186.	Br	2F-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.187.	Br	2Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	-O-
1.188.	Br	2OCH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.189.	H	2OCH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.190.	Br	2,4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.191.	H	2N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.192.	H	4N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.193.	H	2N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.194.	H	2CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	H	H	-O-
1.195.	H	Ph	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.196.	H	Ph	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.197.	H	Ph	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	F	H	H	H	-O-
1.198.	H	4F-Ph	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.199.	H	2,4CH <sub>3</sub> -Ph	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H	CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.200.	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.201.	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.202.	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.203.	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.204.	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.205.	CN	NH <sub>2</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.206.	CN	OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.207.	H	O-(4-FPh)	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.208.	H	O-(3-Cl, 4-FPh)	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.209.	Cl	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.210.	CF <sub>3</sub>	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.211.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.212.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH <sub>3</sub>	H	-O-
1.213.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -
1.214.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		H	Cl	F	H	-O-
1.215.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H	F	H	-
1.216.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	CH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	Cl	H	H	-
1.217.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	Cl	H	H	-
1.218.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.219.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-
1.220.	H	CF <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.221.	H	CF <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-
1.222.	C(=O)O-cyclohexyl	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.223.	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.224.	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-2-
1.225.	CF <sub>3</sub>	H	H	S	OH	H	R	H	H		H	H	H	H	-
1.226.	CF <sub>3</sub>	H	H	S	OH	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.227.	CF <sub>3</sub>	H	H	S	OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H	H	H	-

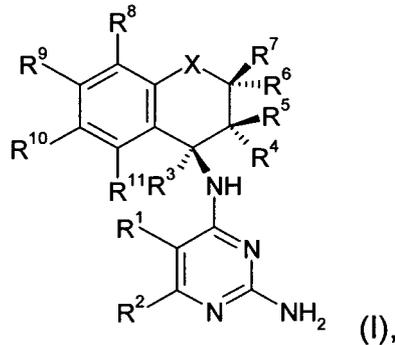
	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.228.	CF <sub>3</sub>	H	H	S	OCH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.229.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		F	H	H	H	-O-
1.230.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		CH <sub>3</sub>	H	H	H	-O-
1.231.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	-
1.232.	CF <sub>3</sub>	H	H	rac	H	H		H	H		H	OCH <sub>2</sub> O	H	-	
1.233.	CF <sub>2</sub> H	H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.234.	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.235.	S(=O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.236.	S(=O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.237.	C(=O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.238.	C(=O)CH <sub>3</sub>	H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.239.	C≡CH	H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.240.	C≡CC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.241.	C≡CSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.242.	C≡CH	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.243.	C≡CSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H	S	H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.244.	CCSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.245.	C(=O)CH <sub>3</sub>	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.246.	C≡CH	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.247.	C≡C-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.248.	C≡C-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.249.	C≡C-Ph	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.250.	Cl	C(=O)OCH <sub>3</sub>	H	R	CH <sub>3</sub>	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Stereo N, R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Stereo R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Stereo R <sup>6</sup> , R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	X
1.251.	Cl	C(=O)OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.252.	Cl	CN	H	R	CH <sub>3</sub>	H		H	H		H	H	CH <sub>3</sub>	H	-
1.253.	Cl	C(=O)NH <sub>2</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.254.	Cl	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.255.	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.256.	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	-O-
1.257.	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -
1.258.	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	-
1.259.	CF <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	-

Weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verfahren zur Herstellung entsprechender Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze und/oder deren agrochemisch verträglichen quarternierten Stickstoff-Derivate:

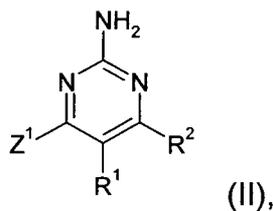
a.) Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I)

5



in welchen die Reste R<sup>1</sup> bis R<sup>11</sup> und X die vorstehenden Bedeutungen aufweisen, kann man eine Verbindung der allgemeinen Formel (II)

10

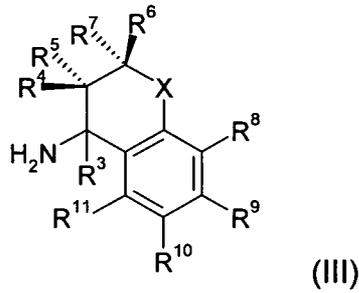


worin R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die vorstehende Bedeutung aufweisen und Z<sup>1</sup> einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, wie insbesondere Chlor, Trichlormethyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylsulfonyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylphenylsulfonyl, bedeutet, mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz davon

15

20

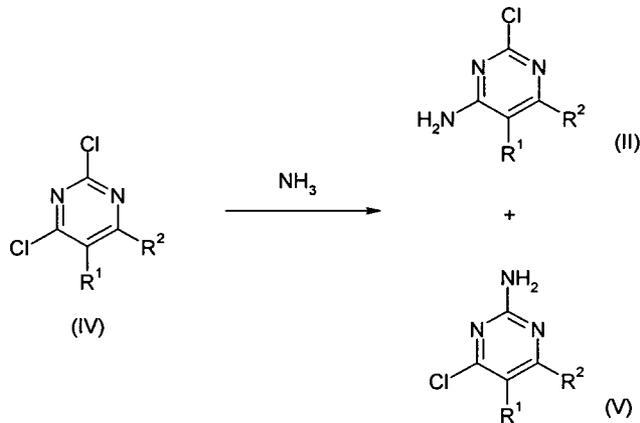
33



umsetzen, wobei die Reste R<sup>3</sup> bis R<sup>11</sup> und X die vorstehende Bedeutung aufweisen.

5

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (II) können für Z = Chlor durch Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Formel (IV) mit Ammoniak gemäß nachfolgendem Reaktionsschema erhalten werden:



10

Das dabei erhaltene Isomerengemisch aus (II) und (V) kann chromatographisch getrennt werden oder als Gemisch in der nachfolgenden Umsetzung verwendet werden.

15

Die Amine der allgemeinen Formel (III) oder die Säureadditionssalz davon sind kommerziell verfügbar oder deren Synthese ist in WO 2004/069814 A1 beschrieben.

20

Die Pyrimidine der allgemeinen Formel (II) sind kommerziell verfügbar; spezielle Derivate können nach bekannten Verfahren hergestellt werden. Beispielsweise

- a. können entsprechend der Veröffentlichung von Perez et al.,  
Synthesis 1983, S. 402, aus Cyanacetamid und N-  
cyanocarboximidoaten die entsprechenden 4-Hydroxy-Pyrimidine  
hergestellt werden, die dann nachfolgend beispielsweise mit  
5 Phosphoroxchlorid in die Verbindungen der allgemeinen Formel  
(II) überführt werden können;
- b. können aus Acetessigestern 4-Hydroxypyrimidine entsprechend  
dem von Gershon et al., J. Heterocyclic Chem., 20, 219 (1983) und  
J. Heterocycl. Chem., 21(4), (1984), 1161 veröffentlichten Verfahren  
10 hergestellt und in Chlorpyrimidine überführt werden.

b.) Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können  
Verbindungen als Vorstufen verwendet werden und wie nachstehend  
ausgeführt in andere erfindungsgemäße Verbindungen umgewandelt werden:

- 15 i. Beispielsweise können Derivate der allgemeinen Formel (I) mit  $R^1$ ,  
 $R^2$  oder  $R^{10}$  = Halogen, insbesondere Iod oder Brom, mit  
Acetylenen oder mit durch Trimethylsilyl geschützten Acetylen unter  
Übergangsmetallkatalyse, z.B. mit Bis-(triphenylphosphin)-  
palladium-(II)-chlorid, in protischen oder aprotischen Lösemitteln  
20 und Basenzusatz bei Temperaturen zwischen 20 und 150 °C zu  
Verbindungen der allgemeinen Formel (I) mit  $R^1$ ,  $R^2$  oder  $R^{10}$  =  
Alkynyl umgesetzt werden.
- 25 ii. Beispielsweise können Derivate der allgemeinen Formel (I) mit  $R^1$  =  
CN sauer oder basenkatalysiert verseift werden; die so erhaltenen  
Carbonsäuren können nach bekannten Verfahren in Säurechloride  
und diese wiederum in Amide überführt werden.
- 30 iii. Beispielsweise können Derivate der allgemeinen Formel (I) mit  $R^2$  =  
Hal in protischen oder aprotischen Lösemitteln und Basenzusatz  
bei Temperaturen zwischen 100 und 250 °C durch Reaktion mit Al-  
koholaten oder Aminen zu Verbindungen der Formel (I) mit  $R^2$  =  
Alkoxyalkyl oder Aminoalkyl oder Diaminoalkyl umgesetzt werden.

Kollektionen aus Verbindungen der Formel (I) und/oder deren Salzen, die nach den oben genannten Reaktionen synthetisiert werden können, können auch in parallelisierter Weise hergestellt werden, wobei dies in manueller, teilweise automatisierter oder vollständig automatisierter Weise geschehen kann. Dabei ist es  
5 beispielsweise möglich, die Reaktionsdurchführung, die Aufarbeitung oder die Reinigung der Produkte bzw. Zwischenstufen zu automatisieren. Insgesamt wird hierunter eine Vorgehensweise verstanden, wie sie beispielsweise durch D. Tiebes in *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley 1999, auf den Seiten 1 bis 34 beschrieben ist.

10

Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, beispielsweise Calpyso-Reaktionsblöcke (Calpyso reaction blocks) der Firma Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA oder Reaktionsstationen (reaction stations) der  
15 Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, England oder MultiPROBE Automated Workstations der Firma Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA. Für die parallelisierte Aufreinigung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen beziehungsweise von bei der Herstellung anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem

20

Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise der Firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den

25

Einsatz von teilweise oder vollständig integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden. Derartige Automationssysteme können zum Beispiel von der Firma Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA bezogen werden.

30

Die Durchführung einzelner oder mehrerer Syntheseschritte kann durch den Einsatz von Polymer-supported reagents/Scavenger-Harze unterstützt werden. In der Fachliteratur sind eine Reihe von Versuchsprotokollen beschrieben, beispielsweise

in ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

5 Neben den hier beschriebenen Methoden kann die Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen vollständig oder partiell durch Festphasen unterstützte Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne Zwischenstufen oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepassten Synthese an ein Syntheseharz gebunden. Festphasen- unterstützte Synthesemethoden sind in der Fachliteratur  
10 hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998 und Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley, 1999. Die Verwendung von Festphasen- unterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten Protokollen, die wiederum manuell oder automatisiert ausgeführt  
15 werden können. Die Reaktionen können beispielsweise mittels IRORI-Technologie in Mikroreaktoren (microreactors) der Firma Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA durchgeführt werden.

20 Sowohl an fester als auch in flüssiger Phase kann die Durchführung einzelner oder mehrerer Syntheseschritte durch den Einsatz der Mikrowellen-Technologie unterstützt werden. In der Fachliteratur sind eine Reihe von Versuchsprotokollen beschrieben, beispielsweise in Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (Herausgeber C. O. Kappe und A. Stadler), Verlag Wiley, 2005.

25 Die Herstellung gemäß der hier beschriebenen Verfahren liefert Verbindungen der Formel (I) und deren Salze in Form von Substanzkollektionen, die Bibliotheken genannt werden. Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Bibliotheken, die mindestens zwei Verbindungen der Formel (I) und deren Salzen enthalten.

30 Weiterer Gegenstand der Erfindung ist aufgrund der herbiziden Eigenschaft der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auch die Verwendung der

erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Herbizide zur Bekämpfung von Schädelpflanzen.

Herbizide werden in landwirtschaftlich genutzten Kulturen während verschiedener Anbauphasen eingesetzt. So erfolgt die Applikation einiger Produkte schon vor oder während der Saat. Andere werden ausgebracht, bevor die Kulturpflanze aufläuft, d.h. bevor der Keimling die Erdoberfläche durchbricht (Voraufauf-Herbizide). Nachaufauf-Herbizide schließlich werden verwendet, wenn von der Kulturpflanze entweder bereits die Keimblätter oder Laubblätter ausgebildet sind.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können dabei sowohl im Vorlauf als auch im Nachlauf angewendet werden, wobei eine Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen im Vorlauf bevorzugt ist.

Die Voraufauf-Behandlung schließt sowohl die Behandlung der Anbaufläche vor der Aussaat (ppi = pre plant incorporation) als auch die Behandlung der angesäten, aber noch nicht bewachsenen Anbauflächen ein.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, im folgenden auch synonym zusammen auch als Verbindungen der Formel (I) bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schädelpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Voraufauf- oder Nachaufaufverfahren ausgebracht werden.

Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

- Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z. B. Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachicaria, Bromus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Festuca, Fimbristylis, Ischaemum, Lolium, Monochoria, 5 Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sphenoclea, sowie Cyperusarten vorwiegend aus der annualen Gruppe und auf Seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt.
- 10 Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z. B. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon und Sida auf der annualen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex und Artemisia bei den perennierenden Unkräutern. Außerdem wird herbizide Wirkung bei dikotylen Unkräutern wie Ambrosia, Anthemis, Carduus, Centaurea, 15 Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Emex, Galeopsis, Galinsoga, Lepidium, Lindernia, Papaver, Portlaca, Polygonum, Ranunculus, Rorippa, Rotala, Seneceio, Sesbania, Solanum, Sonchus, Taraxacum, Trifolium, Urtica und Xanthium beobachtet.
- 20 Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.
- 25 Bei Applikation der Wirkstoffe der allgemeinen Formel (I) auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstopp ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach 30 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 wie z. B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle, Raps und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen der allgemeinen Formel (I) 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 das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften

können die Wirkstoffe auch zur Bekämpfung von Schadpflanzen 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 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.

- Bevorzugt ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der  
5 allgemeinen Formel (I) oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z. B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.
- 10 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.
- Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher  
15 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 (siehe z. B. EP 0221044, EP 0131624). Beschrieben wurden beispielsweise in mehreren Fällen
- 20 a) gentechnische Veränderungen von Kulturpflanzen zwecks Modifikation der in den Pflanzen synthetisierten Stärke (z. B. WO 92/011376, WO 92/014827, WO 91/019806),
- b) transgene Kulturpflanzen, welche gegen bestimmte Herbizide vom Typ  
25 Glufosinate (vgl. z. B. EP 0242236, EP 0242246) oder Glyphosate (WO 92/000377) oder der Sulfonylharnstoffe (EP 0257993, US 5013659) resistent sind,
- c) transgene Kulturpflanzen, beispielsweise Baumwolle, mit der Fähigkeit *Bacillus thuringiensis*-Toxine (Bt-Toxine) zu produzieren, welche die Pflanzen gegen bestimmte Schädlinge resistent machen (EP 0142924, EP 0193259),
- 30 d) transgene Kulturpflanzen mit modifizierter Fettsäurezusammensetzung (WO 91/013972),

- e) gentechnisch veränderte Kulturpflanzen mit neuen Inhalts- oder Sekundärstoffen z. B. neuen Phytoalexinen, die eine erhöhte Krankheitsresistenz verursachen (EP 0309862, EP 0464461),
- f) gentechnisch veränderte Pflanzen mit reduzierter Photorespiration, die höhere Erträge und höhere Stresstoleranz aufweisen (EP 0305398),
- g) transgene Kulturpflanzen, die pharmazeutisch oder diagnostisch wichtige Proteine produzieren („molecular pharming“),
- h) transgene Kulturpflanzen, die sich durch höhere Erträge oder bessere Qualität auszeichnen,
- 10 i) transgene Kulturpflanzen die sich durch eine Kombination z. B. der o. g. neuen Eigenschaften auszeichnen („gene stacking“).

Zahlreiche molekularbiologische Techniken, mit denen neue transgene Pflanzen mit veränderten Eigenschaften hergestellt werden können, sind im Prinzip bekannt; siehe z. B. I. Potrykus und G. Spangenberg (eds.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg oder Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431.

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 oder synthetische Sequenzen hinzugefügt werden. Für die Verbindung der DNA-Fragmente untereinander können an die Fragmente Adaptoren oder Linker angesetzt werden, siehe z. B. Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2. Aufl. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; oder Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2. Auflage 1996.

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA, 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  
5 codierende Sequenz eines 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  
10 Sequenzen eines Genprodukts aufweisen, aber nicht vollkommen identisch sind.  
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  
15 einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige Sequenzen sind dem  
Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-  
3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al.,  
Plant J. 1 (1991), 95-106). Die Expression der Nucleinsäuremoleküle kann auch in  
den Organellen der Pflanzenzellen stattfinden.

20 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.

25 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.

30 Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen  
Formel (I) in transgenen Kulturen eingesetzt werden, welche gegen Wachstumsstoffe,

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

5 Benzoylisoxazole und analogen Wirkstoffe, resistent sind.

Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe 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

10 in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, 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

15 Kulturpflanzen.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in transgenen Kulturpflanzen.

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

25 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-,

30 Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikro kapseln und Wachse.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösemittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls 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. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z. B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Fungiziden, sowie mit Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z. B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

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, Fettalkoholpolyglykoethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-Dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoymethyltaurinsäures 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.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösemittel z. B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösemittel 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.

15

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

20

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z. B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

25

Emulsionen, z. B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rühren, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösemitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z. B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

30

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, 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.

5

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 Sprühgranulate siehe z. B.

10 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.

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z. B.

15 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.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I).

20

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,

25

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

30

Granulierhilfsmittel, Füllstoffe u.a. 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.-%.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösemittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

Die 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, Sa-

10 fenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren kombiniert eingesetzt werden.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Verbindungen in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte

15 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. aus Weed Research 26 (1986) 441-445 oder "The Pesticide Manual",

20 13th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als bekannte Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International

25 Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen oder mit der Codenummer bezeichnet) und umfassen stets sämtliche Anwendungsformen wie Säuren, Salze, Ester und Isomere wie Stereoisomere und optische Isomere. Dabei sind beispielhaft eine und zum Teil auch mehrere Anwendungsformen genannt:

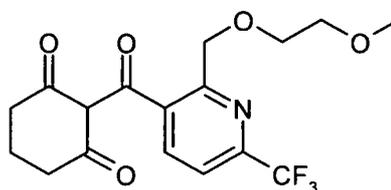
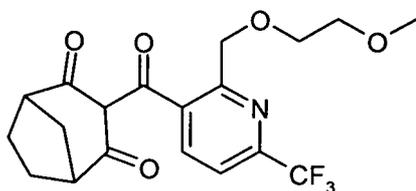
30 Acetochlor, Acibenzolar, Acibenzolar-S-methyl, Acifluorfen, Acifluorfen-sodium, Aclonifen, Alachlor, Allidochlor, Alloxydim, Alloxydim-sodium, Ametryn,

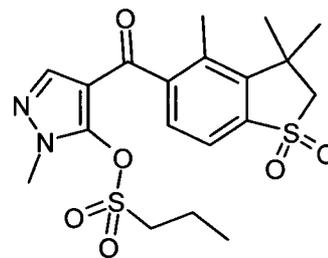
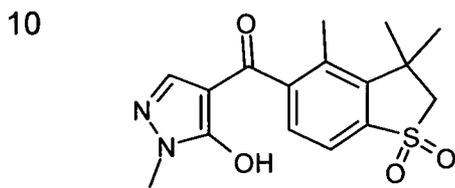
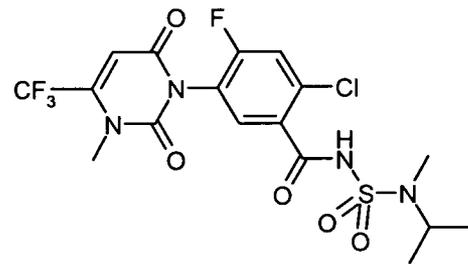
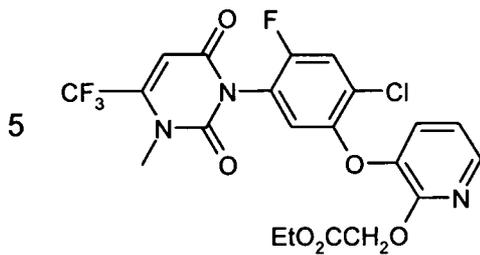
Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Aminopyralid, Amitrole,  
Ammoniumsulfamat, Ancymidol, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin,  
Azimsulfuron, Aziprotryn, BAH-043, BAS-140H, BAS-693H, BAS-714H, BAS-762H,  
BAS-776H, BAS-800H, Beflubutamid, Benazolin, Benazolin-ethyl, Bencarbazone,  
5 Benfluralin, Benfuresate, Bensulide, Bensulfuron-methyl, Bentazone, Benzfendizone,  
Benzobicyclon, Benzofenap, Benzofluor, Benzoylprop, Bifenox, Bilanafos, Bilanafos-  
natrium, Bispyribac, Bispyribac-natrium, Bromacil, Bromobutide, Bromofenoxim,  
Bromoxynil, Bromuron, Buminafos, Busoxinone, Butachlor, Butafenacil, Butamifos,  
Butenachlor, Butralin, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Carbetamide,  
10 Carfentrazone, Carfentrazone-ethyl, Chlomethoxyfen, Chloramben, Chlorazifop,  
Chlorazifop-butyl, Chlorbromuron, Chlorbufam, Chlorfenac, Chlorfenac-natrium,  
Chlorfenprop, Chlorflurenol, Chlorflurenol-methyl, Chloridazon, Chlorimuron,  
Chlorimuron-ethyl, Chlormequat-chlorid, Chlornitrofen, Chlorophthalim, Chlorthal-  
dimethyl, Chlorotoluron, Chlorsulfuron, Cinidon, Cinidon-ethyl, Cinmethylin,  
15 Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop Clodinafop-propargyl, Clofencet, Clomazone,  
Clomeprop, Cloprop, Clopyralid, Cloransulam, Cloransulam-methyl, Cumyluron,  
Cyanamide, Cyanazine, Cyclanilide, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim,  
Cycluron, Cyhalofop, Cyhalofop-butyl, Cyperquat, Cyprazine, Cyprazole, 2,4-D, 2,4-  
DB, Daimuron/Dymron, Dalapon, Daminozide, Dazomet, n-Decanol, Desmedipham,  
20 Desmetryn, Detosyl-Pyrazolate (DTP), Diallylate, Dicamba, Dichlobenil, Dichlorprop,  
Dichlorprop-P, Diclofop, Diclofop-methyl, Diclofop-P-methyl, Diclosulam, Diethylatyl,  
Diethylatyl-ethyl, Difenoxuron, Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Diflufenzopyr-  
natrium, Dimefuron, Dikegulac-sodium, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor,  
Dimethametryn, Dimethenamid, Dimethenamid-P, Dimethipin, Dimetrasulfuron,  
25 Dinitramine, Dinoseb, Dinoterb, Diphenamid, Dipropetryn, Diquat, Diquat-dibromide,  
Dithiopyr, Diuron, DNOC, Eglinazine-ethyl, Endothal, EPTC, Esprocarb, Ethalfuralin,  
Ethametsulfuron-methyl, Ethephon, Ethidimuron, Ethiozin, Ethofumesate, Ethoxyfen,  
Ethoxyfen-ethyl, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, F-5331, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-  
(3fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid,  
30 Fenoprop, Fenoxaprop, Fenoxaprop-P, Fenoxaprop-ethyl, Fenoxaprop-P-ethyl,  
Fentrazamide, Fenuron, Flamprop, Flamprop-M-isopropyl, Flamprop-M-methyl,  
Flzasulfuron, Florasulam, Fluazifop, Fluazifop-P, Fluazifop-butyl, Fluazifop-P-butyl,

Fluazolate, Flucarbazone, Flucarbazone-sodium, Flucetosulfuron, Fluchloralin,  
 Flufenacet (Thiafluamide), Flufenpyr, Flufenpyr-ethyl, Flumetralin, Flumetsulam,  
 Flumiclorac, Flumiclorac-pentyl, Flumioxazin, Flumipropyn, Fluometuron,  
 Fluorodifen, Fluoroglycofen, Fluoroglycofen-ethyl, Flupoxam, Flupropacil,  
 5 Flupropanate, Flupyrsulfuron, Flupyrsulfuron-methyl-sodium, Flurenol, Flurenol-butyl,  
 Fluridone, Flurochloridone, Fluroxypyr, Fluroxypyr-meptyl, Flurprimidol, Flurtamone,  
 Fluthiacet, Fluthiacet-methyl, Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron,  
 Forchlorfenuron, Fosamine, Furyloxyfen, Gibberellinsäure, Glufosinate, L-  
 Glufosinate, L-Glufosinate-ammonium, Glufosinate-ammonium, Glyphosate,  
 10 Glyphosate-isopropylammonium, H-9201, Halosafen, Halosulfuron, Halosulfuron-  
 methyl, Haloxyfop, Haloxyfop-P, Haloxyfop-ethoxyethyl, Haloxyfop-P-ethoxyethyl,  
 Haloxyfop-methyl, Haloxyfop-P-methyl, Hexazinone, HNPC-9908, HOK-201, HW-02,  
 Imazamethabenz, Imazamethabenz-methyl, Imazamox, Imazapic, Imazapyr,  
 Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Inabenfide, Indanofan, Indolessigsäure  
 15 (IAA), 4-Indol-3-ylbuttersäure (IBA), Iodosulfuron, Iodosulfuron-methyl-natrium,  
 Ioxynil, Isocarbamid, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole,  
 Isoxaflutole, Isoxapyrifop, IDH-100, KUH-043, KUH-071, Karbutilate, Ketospiradox,  
 Lactofen, Lenacil, Linuron, Maleinsäurehydrazid, MCPA, MCPB, MCPB-methyl, -  
 ethyl und -natrium, Mecoprop, Mecoprop-natrium, Mecoprop-butotyl, Mecoprop-P-  
 20 butotyl, Mecoprop-P-dimethylammonium, Mecoprop-P-2-ethylhexyl, Mecoprop-P-  
 kalium, Mefenacet, Mefluidide, Mepiquat-chlorid, Mesosulfuron, Mesosulfuron-  
 methyl, Mesotrione, Methabenzthiazuron, Metam, Metamifop, Metamitron,  
 Metazachlor, Methazole, Methoxyphenone, Methyldymron, 1-Methylcyclopropen,  
 Methylisothiocyanat, Metobenzuron, Metobenzuron, Metobromuron, Metolachlor, S-  
 25 Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron, Metsulfuron-methyl,  
 Molinate, Monalide, Monocarbamide, Monocarbamide-dihydrogensulfat,  
 Monolinuron, Monosulfuron, Monuron, MT 128, MT-5950, d. h. N-[3-Chlor-4-(1-  
 methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid, NGGC-011, Naproanilide, Napropamide,  
 Naptalam, NC-310, d.h. 4-(2,4-dichlorobenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxy-pyrazole,  
 30 Neburon, Nicosulfuron, Nipyraclofen, Nitralin, Nitrofen, Nitrophenolat-natrium  
 (Isomerengemisch), Nitrofluorfen, Nonansäure, Norflurazon, Orbencarb,  
 Orthosulfamuron, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone,

Oxyfluorfen, Paclobutrazol, Paraquat, Paraquat-dichlorid, Pelargonsäure (Nonansäure), Pendimethalin, Pendralin, Penoxsulam, Pentanochlor, Pentoxazone, Perfluidone, Pethoxamid, Phenisopham, Phenmedipham, Phenmedipham-ethyl, Picloram, Picolinafen, Pinoxaden, Piperophos, Pirifenop, Pirifenop-butyl, Pretilachlor, 5 Primisulfuron, Primisulfuron-methyl, Probenazole, Profluazol, Procyazine, Prodiamine, Prifluraline, Profoxydim, Prohexadione, Prohexadione-calcium, Prohydrojasnone, Prometon, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propazine, Propham, Propisochlor, Propoxycarbazone, Propoxycarbazone-natrium, Propyzamide, Prosulfalin, Prosulfocarb, Prosulfuron, Prynachlor, Pyraclonil, 10 Pyraflufen, Pyraflufen-ethyl, Pyrasulfotole, Pyrazolynate (Pyrazolate), Pyrazosulfuron-ethyl, Pyrazoxyfen, Pyribambenz, Pyribambenz-isopropyl, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridafol, Pyridate, Pyriftalid, Pyriminobac, Pyriminobac-methyl, Pyrimisulfan, Pyriothiobac, Pyriothiobac-natrium, Pyroxasulfone, Pyroxsulam, Quinclorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop, Quizalofop-ethyl, Quizalofop-P, 15 Quizalofop-P-ethyl, Quizalofop-P-tefuryl, Rimsulfuron, Secbumeton, Sethoxydim, Siduron, Simazine, Simetryn, SN-106279, Sulcotrione, Sulfallate (CDEC), Sulfentrazone, Sulfometuron, Sulfometuron-methyl, Sulfosate (Glyphosate-trimesium), Sulfosulfuron, SYN-523, SYP-249, SYP-298, SYP-300, Tebutam, Tebuthiuron, Tecnazene, Tefuryltrione, Tembotrione, Tepraloxymid, Terbacil, 20 Terbucarb, Terbuchlor, Terbumeton, Terbuthylazine, Terbutryn, TH-547, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazafluron, Thiazopyr, Thidiazimin, Thidiazuron, Thiencarbazone, Thiencarbazone-methyl, Thifensulfuron, Thifensulfuron-methyl, Thiobencarb, Tiocarbazil, Topramezone, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Triaziflam, Triazofenamid, Tribenuron, Tribenuron-methyl, Trichloessigsäure 25 (TCA), Triclopyr, Tridiphane, Trietazine, Trifloxysulfuron, Trifloxysulfuron-natrium, Trifluralin, Triflusulfuron, Triflusulfuron-methyl, Trimeturon, Trinexapac, Trinexapac-ethyl, Tritosulfuron, Tsitodef, Uniconazole, Uniconazole-P, Vernolate, ZJ-0166, ZJ-0270, ZJ-0543, ZJ-0862 sowie die folgenden Verbindungen

30





15

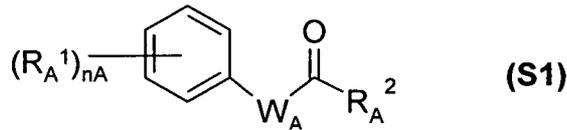
Von besonderem Interesse ist die selektive Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen. Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bereits in vielen Kulturen sehr gute bis ausreichende Selektivität aufweisen, können prinzipiell in einigen Kulturen und vor allem auch im Falle von Mischungen mit anderen Herbiziden, die weniger selektiv sind, Phytotoxizitäten an den Kulturpflanzen auftreten. Diesbezüglich sind Kombinationen erfindungsgemäßer Verbindungen der allgemeinen Formel (I) von besonderem Interesse, welche die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. deren Kombinationen mit anderen Herbiziden oder Pestiziden und 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.

Die Safener sind vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

Die Safener sind vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

35

S1) Verbindungen der Formel (S1),



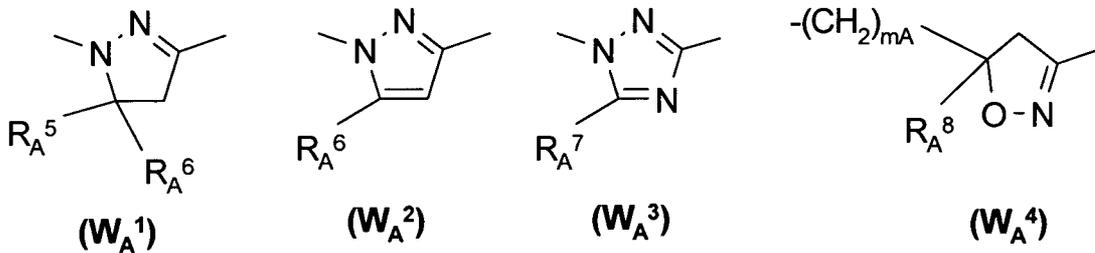
wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

$n_A$  ist eine natürliche Zahl von 0 bis 5, vorzugsweise 0 bis 3;

5  $R_A^1$  ist Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Nitro oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl;

$W_A$  ist ein unsubstituierter oder substituierter divalenter heterocyclischer Rest aus der Gruppe der teilungesättigten oder aromatischen Fünfring-Heterocyclen mit 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N und O, wobei mindestens ein N-Atom und höchstens ein O-Atom im Ring enthalten ist, vorzugsweise ein Rest aus der Gruppe ( $W_A^1$ ) bis ( $W_A^4$ ),

10



$m_A$  ist 0 oder 1;

15  $R_A^2$  ist  $OR_A^3$ ,  $SR_A^3$  oder  $NR_A^3R_A^4$  oder ein gesättigter oder ungesättigter 3- bis 7-gliedriger Heterocyclus mit mindestens einem N-Atom und bis zu 3 Heteroatomen, vorzugsweise aus der Gruppe O und S, der über das N-Atom mit der Carbonylgruppe in (S1) verbunden ist und unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl substituiert ist, vorzugsweise ein Rest der Formel  $OR_A^3$ ,  $NHR_A^4$  oder  $N(CH_3)_2$ , insbesondere der Formel  $OR_A^3$ ;

20

$R_A^3$  ist Wasserstoff oder ein unsubstituierter oder substituierter aliphatischer Kohlenwasserstoffrest, vorzugsweise mit insgesamt 1 bis 18 C-Atomen;

$R_A^4$  ist Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy oder substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl;

$R_A^5$  ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, Cyano oder COOR<sub>A</sub><sup>9</sup>, worin R<sub>A</sub><sup>9</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Hydroxyalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)Cycloalkyl oder Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-silyl ist;

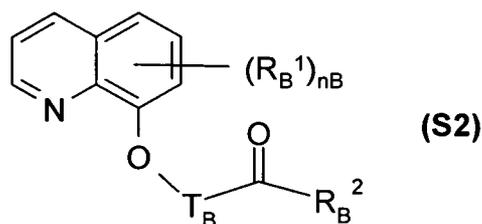
5  $R_A^6$ ,  $R_A^7$ ,  $R_A^8$  sind gleich oder verschieden Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)Cycloalkyl oder substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl;

vorzugsweise:

- 10 a) Verbindungen vom Typ der Dichlorphenylpyrazolin-3-carbonsäure (S1<sup>a</sup>), vorzugsweise Verbindungen wie  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäure, 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäure-ethylester (S1-1) ("Mefenpyr-diethyl"), und verwandte Verbindungen, wie sie in der WO-A-91/07874 beschrieben sind;
- 15 b) Derivate der Dichlorphenylpyrazolcarbonsäure (S1<sup>b</sup>), vorzugsweise Verbindungen wie 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-methyl-pyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-2), 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-isopropyl-pyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-3), 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(1,1-dimethyl-ethyl)pyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-4) und verwandte Verbindungen, wie sie in  
20 EP-A-333 131 und EP-A-269 806 beschrieben sind;
- c) Derivate der 1,5-Diphenylpyrazol-3-carbonsäure (S1<sup>c</sup>), vorzugsweise Verbindungen wie 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;
- 25 d) Verbindungen vom Typ der Triazolcarbonsäuren (S1<sup>d</sup>), vorzugsweise Verbindungen wie Fenchlorazol(-ethylester), d.h.  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-trichlormethyl-(1H)-1,2,4-triazol-3-carbonsäure-ethylester (S1-7), und verwandte Verbindungen wie sie in EP-A-174 562 und  
30 EP-A-346 620 beschrieben sind;
- e) Verbindungen vom Typ der 5-Benzyl- oder 5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure oder der 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure (S1<sup>e</sup>), vorzugsweise

Verbindungen wie 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-carbonsäureethylester (S1-11) ("Isoxadifen-ethyl") oder -n-propylester (S1-12) oder der 5-(4-Fluorphenyl)-5-phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-13), wie sie in der Patentanmeldung WO-A-95/07897 beschrieben sind.

10 S2) Chinolinderivate der Formel (S2),



wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

$R_B^1$  ist Halogen,  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy, Nitro oder  $(C_1-C_4)$ Haloalkyl;

$n_B$  ist eine natürliche Zahl von 0 bis 5, vorzugsweise 0 bis 3;

$R_B^2$  ist  $OR_B^3$ ,  $SR_B^3$  oder  $NR_B^3R_B^4$  oder ein gesättigter

15 oder ungesättigter 3- bis 7-gliedriger Heterocyclus mit mindestens einem N-Atom und bis zu 3 Heteroatomen, vorzugsweise aus der Gruppe O und S, der über das N-Atom mit der Carbonylgruppe in (S2) verbunden ist und unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl substituiert ist, vorzugsweise ein Rest der Formel  $OR_B^3$ ,  $NHR_B^4$  oder  $N(CH_3)_2$ , insbesondere der Formel  $OR_B^3$ ;

$R_B^3$  ist Wasserstoff oder ein unsubstituierter oder substituierter aliphatischer Kohlenwasserstoffrest, vorzugsweise mit insgesamt 1 bis 18 C-Atomen;

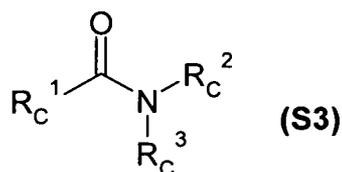
$R_B^4$  ist Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ Alkyl,  $(C_1-C_6)$ Alkoxy oder substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl;

25  $T_B$  ist eine  $(C_1$  oder  $C_2)$ -Alkandiyolkette, die unsubstituiert oder mit einem oder zwei  $(C_1-C_4)$ Alkylresten oder mit  $[(C_1-C_3)$ -Alkoxy]-carbonyl substituiert ist;

vorzugsweise:

- a) Verbindungen vom Typ der 8-Chinolinoxinessigsäure (S2<sup>a</sup>), 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 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-4-allyloxy-butylester (S2-3),  
 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-1-allyloxy-prop-2-ylester (S2-4),  
 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäureethylester (S2-5),  
 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäuremethylester (S2-6),  
 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäureallylester (S2-7),  
 10 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-2-(2-propyliden-iminoxy)-1-ethylester (S2-8), (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-2-oxo-prop-1-ylester (S2-9) und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-86 750, EP-A-94 349 und EP-A-191 736 oder EP-A-0 492 366 beschrieben sind, sowie (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure (S2-10), deren Hydrate und Salze, beispielsweise deren Lithium-, Natrium- Kalium-, Kalzium-, Magnesium-, Aluminium-, Eisen-,  
 15 Ammonium-, quartäre Ammonium-, Sulfonium-, oder Phosphoniumsalze wie sie in der WO-A-2002/34048 beschrieben sind;
- b) Verbindungen vom Typ der (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure (S2<sup>b</sup>), vorzugsweise Verbindungen wie (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäurediethylester,  
 20 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäurediallylester, (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-methyl-ethylester und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-0 582 198 beschrieben sind.

S3) Verbindungen der Formel (S3)



25

wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

R<sub>C</sub><sup>1</sup> ist (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)Cycloalkyl, vorzugsweise Dichlormethyl;

$R_C^2$ ,  $R_C^3$  sind gleich oder verschieden Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylcarbamoyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylcarbamoyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, Dioxolanyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, Thiazolyl, Furyl, Furylalkyl, Thienyl, Piperidyl, substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl, oder  $R_C^2$  und  $R_C^3$  bilden zusammen einen substituierten oder unsubstituierten heterocyclischen Ring, vorzugsweise einen Oxazolidin-, Thiazolidin-, Piperidin-, Morpholin-, Hexahydropyrimidin- oder Benzoxazinring;

10 vorzugsweise:

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

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

15 "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),

20 "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),

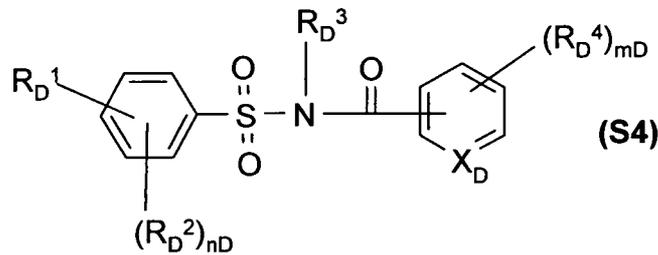
"AD-67" oder "MON 4660" (3-Dichloracetyl-1-oxa-3-aza-spiro[4,5]decan) der Firma Nitrokemia bzw. Monsanto (S3-7),

25 "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,

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

S4) N-Acylsulfonamide der Formel (S4) und ihre Salze,



worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

$X_D$  ist CH oder N;

5  $R_D^1$  ist  $CO-NR_D^5R_D^6$  oder  $NHCO-R_D^7$ ;

$R_D^2$  ist Halogen,  $(C_1-C_4)$ Haloalkyl,  $(C_1-C_4)$ Haloalkoxy, Nitro,  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy,  $(C_1-C_4)$ Alkylsulfonyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy-carbonyl oder  $(C_1-C_4)$ Alkylcarbonyl;

$R_D^3$  ist Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_2-C_4)$ Alkenyl oder  $(C_2-C_4)$ Alkinyl;

10  $R_D^4$  ist Halogen, Nitro,  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_1-C_4)$ Haloalkyl,  $(C_1-C_4)$ Haloalkoxy,  $(C_3-C_6)$ Cycloalkyl, Phenyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy, Cyano,  $(C_1-C_4)$ Alkylthio,  $(C_1-C_4)$ Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ Alkylsulfonyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy-carbonyl oder  $(C_1-C_4)$ Alkylcarbonyl;

15  $R_D^5$  ist Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ Alkyl,  $(C_3-C_6)$ Cycloalkyl,  $(C_2-C_6)$ Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ Alkinyl,  $(C_5-C_6)$ Cycloalkenyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl enthaltend  $v_D$  Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sieben letztgenannten Reste durch  $v_D$  Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $(C_1-C_6)$ Alkoxy,  $(C_1-C_6)$ Haloalkoxy,  $(C_1-C_2)$ Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_2)$ Alkylsulfonyl,  $(C_3-C_6)$ Cycloalkyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy-carbonyl,  $(C_1-C_4)$ Alkylcarbonyl und Phenyl und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$  Alkyl und  $(C_1-C_4)$ Haloalkyl substituiert sind;

20

$R_D^6$  ist Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ Alkyl,  $(C_2-C_6)$ Alkenyl oder  $(C_2-C_6)$ Alkinyl, wobei die drei letztgenannten Reste durch  $v_D$  Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy,  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy und  $(C_1-C_4)$ Alkylthio substituiert sind, oder

25  $R_D^5$  und  $R_D^6$  gemeinsam mit dem dem sie tragenden Stickstoffatom einen Pyrrolidinyl- oder Piperidinyl-Rest bilden;

$R_D^7$  ist Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ Alkylamino, Di- $(C_1-C_4)$ alkylamino,  $(C_1-C_6)$ Alkyl,  $(C_3-C_6)$ Cycloalkyl, wobei die 2 letztgenannten Reste durch  $v_D$  Substituenten

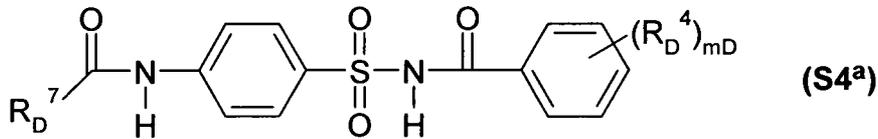
aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl substituiert sind;

$n_D$  ist 0, 1 oder 2;

5  $m_D$  ist 1 oder 2;

$v_D$  ist 0, 1, 2 oder 3;

davon bevorzugt sind Verbindungen von Typ der N-Acylsulfonamide, z.B. der nachfolgenden Formel (S4<sup>a</sup>), die z. B. bekannt sind aus WO-A-97/45016



worin

$R_D^7$  (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Cycloalkyl, wobei die 2 letztgenannten Reste durch  $v_D$  Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl substituiert sind;

15

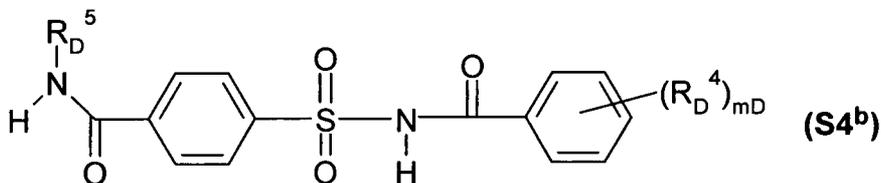
$R_D^4$  Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, CF<sub>3</sub>;

$m_D$  1 oder 2;

$v_D$  ist 0, 1, 2 oder 3 bedeutet;

20 sowie

Acylsulfamoylbenzoesäureamide, z.B. der nachfolgenden Formel (S4<sup>b</sup>), die z.B. bekannt sind aus WO-A-99/16744,



z.B. solche worin

25  $R_D^5$  = Cyclopropyl und ( $R_D^4$ ) = 2-OMe ist ("Cyprosulfamide", S4-1),

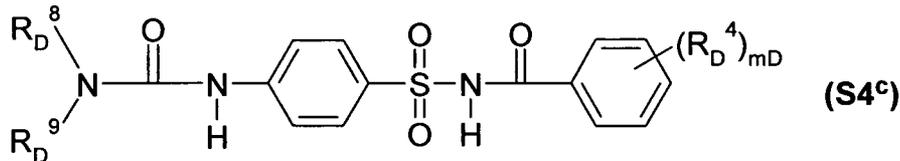
$R_D^5$  = Cyclopropyl und ( $R_D^4$ ) = 5-Cl-2-OMe ist (S4-2),

$R_D^5$  = Ethyl und ( $R_D^4$ ) = 2-OMe ist (S4-3),

$R_D^5$  = Isopropyl und  $(R_D^4) = 5\text{-Cl-2-OMe}$  ist (S4-4) und  
 $R_D^5$  = Isopropyl und  $(R_D^4) = 2\text{-OMe}$  ist (S4-5).

sowie

- 5 Verbindungen vom Typ der N-Acylsulfamoylphenylharnstoffe der Formel  
 (S4<sup>c</sup>), die z.B. bekannt sind aus der EP-A-365484,



worin

- $R_D^8$  und  $R_D^9$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $(C_1\text{-}C_8)$ Alkyl,  $(C_3\text{-}C_8)$ Cycloalkyl,  
 10  $(C_3\text{-}C_6)$ Alkenyl,  $(C_3\text{-}C_6)$ Alkynyl,  
 $R_D^4$  Halogen,  $(C_1\text{-}C_4)$ Alkyl,  $(C_1\text{-}C_4)$ Alkoxy,  $CF_3$   
 $m_D$  1 oder 2 bedeutet;

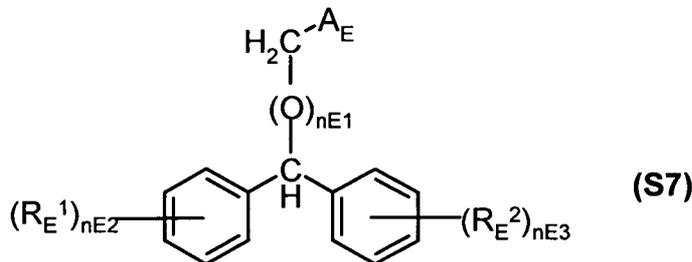
beispielsweise

- 15 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.

- S5) Wirkstoffe aus der Klasse der Hydroxyaromaten und der aromatisch-  
 20 aliphatischen Carbonsäurederivate (S5), z.B.  
 3,4,5-Triacetoxybenzoesäureethylester, 3,5-Dimethoxy-4-hydroxybenzoe-  
 säure, 3,5-Dihydroxybenzoesäure, 4-Hydroxysalicylsäure, 4-Fluorsalicyl-  
 säure, 2-Hydroxyzimtsäure, 2,4-Dichlorzimtsäure, wie sie in der WO-A-  
 2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001 beschrieben sind.

- 25  
 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-  
 dihydrochinoxalin-2-thion, 1-(2-Aminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-  
 chinoxalin-2-on-hydrochlorid, 1-(2-Methylsulfonylaminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-  
 30 dihydro-chinoxalin-2-on, wie sie in der WO-A-2005/112630 beschrieben sind.

S7) Verbindungen der Formel (S7), wie sie in der WO-A-1998/38856 beschrieben sind



5 worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

$R_E^1, R_E^2$  sind unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylamino, Nitro;

$A_E$  ist COOR<sub>E</sub><sup>3</sup> oder COSR<sub>E</sub><sup>4</sup>

10  $R_E^3, R_E^4$  sind unabhängig voneinander Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, Cyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, Phenyl, Nitrophenyl, Benzyl, Halobenzyl, Pyridinylalkyl und Alkylammonium,

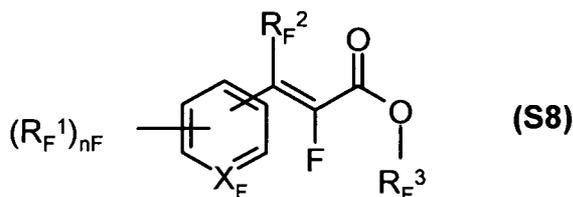
$n_E^1$  ist 0 oder 1

$n_E^2, n_E^3$  sind unabhängig voneinander 0, 1 oder 2,

vorzugsweise:

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

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



worin

$X_F$  CH oder N,

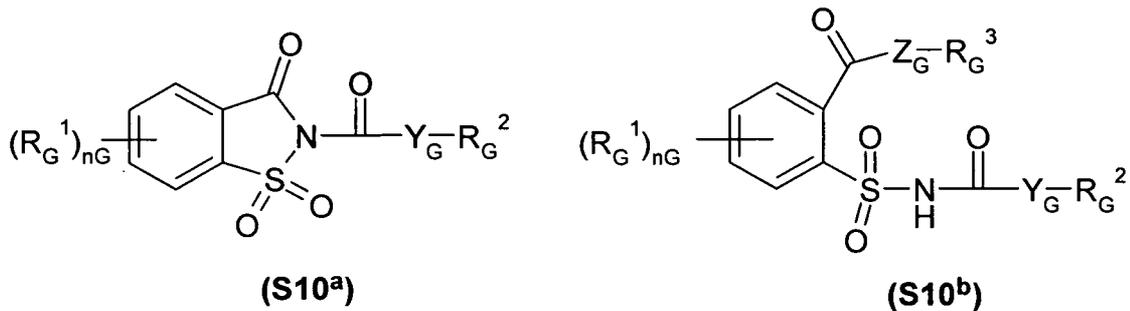
- $n_F$  für den Fall, dass  $X_F=N$  ist, eine ganze Zahl von 0 bis 4 und  
für den Fall, dass  $X_F=CH$  ist, eine ganze Zahl von 0 bis 5 ,
- $R_F^1$  Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy,  
Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl, ggf. substituier-  
tes. Phenyl, ggf. substituiertes Phenoxy,
- $R_F^2$  Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl
- $R_F^3$  Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)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; bedeuten, oder deren Salze,

vorzugsweise Verbindungen worin

- $X_F$  CH,
- $n_F$  eine ganze Zahl von 0 bis 2 ,
- $R_F^1$  Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy,
- $R_F^2$  Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl,
- $R_F^3$  Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)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, bedeuten, oder deren Salze.

- 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.

- S10) Verbindungen der Formeln (S10<sup>a</sup>) oder (S10<sup>b</sup>)  
wie sie in der WO-A-2007/023719 und WO-A-2007/023764 beschrieben sind



worin

5  $R_G^1$  Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, Methoxy, Nitro, Cyano, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>

$Y_G, Z_G$  unabhängig voneinander O oder S,

$n_G$  eine ganze Zahl von 0 bis 4,

$R_G^2$  (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Cycloalkyl, Aryl; Benzyl, Halogenbenzyl,

$R_G^3$  Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl bedeutet.

10

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

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

15

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

20

S12) Wirkstoffe aus der Klasse der Isothiochromanone (S12), wie z.B. Methyl-[(3-oxo-1H-2-benzothiopyran-4(3H)-yliden)methoxy]acetate (CAS-Reg.Nr.

25

205121-04-6) (S12-1) und verwandte Verbindungen aus WO-A-1998/13361.

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

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

"Fenclorim" (4,6-Dichlor-2-phenylpyrimidin) (S13-2), das als Safener für Preti-  
5 lachlor in gesättem 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 Meto-  
lachlor bekannt ist,

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

10 (4-Carboxy-3,4-dihydro-2H-1-benzopyran-4-essigsäure) (S13-4) der Firma American Cyanamid, das als Safener für Mais gegen Schäden von Imidazol-  
nonen 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,

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

(2-propenyl 1-oxa-4-azaspiro[4.5]decane-4-carbodithioate) (S13-6) der Firma Nitrokemia,

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

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

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

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

25 "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 Reis gegen Schäden des Herbizids Imazosulfuron bekannt ist,

30 "Cumyluron" = "JC-940" (3-(2-Chlorphenylmethyl)-1-(1-methyl-1-phenylethyl)harnstoff, siehe JP-A-60087254), 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, "CSB" (1-Brom-4-(chlormethylsulfonyl)benzol) von Kumiai, (CAS-Reg.Nr. 54091-06-4), das als Safener gegen Schäden einiger Herbizide in Reis be-

5

S15) Wirkstoffe, die vorrangig als Herbizide eingesetzt werden, jedoch auch Safenerwirkung auf Kulturpflanzen aufweisen, z.B.

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

10

(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,

15

4-(4-Chlorphenoxy)buttersäure,

3,6-Dichlor-2-methoxybenzoesäure (Dicamba),

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

Einige der Safener sind bereits als Herbizide bekannt und entfalten somit neben der Herbizidwirkung bei Schadpflanzen zugleich auch Schutzwirkung bei den Kulturpflanzen.

20

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 Formel (I) oder deren Mischungen mit weiteren Herbiziden/Pestiziden formuliert werden und als Fertigformulierung oder Tankmischung mit den Herbiziden bereitgestellt und angewendet werden.

25

30

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren

Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

5

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der allgemeinen Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z. B. zwischen 0,001 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch

10 zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

Die vorliegende Erfindung wird anhand der nachfolgenden Beispiele näher erläutert, welche die Erfindung jedoch keinesfalls beschränken.

## 15 A. Synthesebeispiele

Herstellbeispiele:

2-Amino-4-indanyl-1-amino-6-methyl-pyrimidin (Bsp.: I-4)

20

Eine Mischung aus 2.9 g (20 mmol) 2-Amino-4-chlor-6-methyl-pyrimidin, 2.9 g (22 mmol) 1-Aminoindan und 4.1 g (30 mmol) Kaliumcarbonat in 30 ml

Dimethylformamid wird 3 Stunden auf 145 °C erhitzt. Nach Abkühlen wird das Reaktionsgemisch hydrolysiert, die wässrige Mischung wird mit Methylenchlorid

25 extrahiert, die abgetrennte organische Phase mit Natriumsulfat getrocknet. Nach

Abfiltrieren des Trockenmittels und einengen der organischen Phase wird das Rohgemisch mittels säulenchromatographischer Trennung mit

Essigester/Methanol/Triethylamin 90/10/1 als Laufmittel getrennt. Das so erhaltene 2-Amino-4-indanyl-1-amino-6-methyl-pyrimidin wird in Essigester/Heptan 2:8

30 aufgenommen und mit Aktiv-Kohle behandelt. Nach Abtrennung der Aktiv-Kohle und einengen des Lösemittels erhält man 1 g 2-Amino-4-indanyl-1-amino-6-methyl-pyrimidin (glasartig fest, Smp.: 53 -54 °C, 20 % Ausbeute, 95 % Reinheit).

N4-[(1R,2S)-2,6-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]-6-(trifluoromethyl)pyrimidine-2,4-diamin (Bsp.: I-27)

- 5 Eine Mischung aus 0.3 g (1.5 mmol) 2-Amino-4-chlor-6-trifluormethyl-pyrimidin, 0.3 g (1.5 mmol) (1R,2S)-2,6-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-aminiumchlorid und 0.53 g (3.8 mmol) Kaliumcarbonat in 3 ml Dimethylformamid wird 5 Stunden auf 120 °C erhitzt. Nach Abkühlen wird das Reaktionsgemisch auf Kieselgel aufgezogen und säulenchromatographisch mit Essigester/Heptan als Laufmittel gereinigt. Nach
- 10 Einengen erhält man 0.24 g festes N4-[(1R,2S)-2,6-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]-6-(trifluoromethyl)pyrimidin-2,4-diamin (44 % Ausbeute, 90 % Reinheit).

- Zu einer Mischung aus 85 ml Phosphoroxychlorid und 47.5 ml Dimethylanilin gibt man portionsweise (jeweils ca. 5 g) 33.4 g (0.186 mol) 4-Hydroxy-6-trifluoromethyl-pyrimidin-2-yl-amin und erhitzt die Mischung solange zum Rückfluß bis sich der zu-
- 15 gefügte Feststoff gelöst hat. Die Mischung wird anschließend weitere 90 Minuten zum Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen wird die Reaktionsmischung unter Beachtung der Vorsichtsmaßnahmen für Phosphoroxychlorid auf Eiswasser gegeben. Die wässrige Phase wird mit Methylenchlorid extrahiert, die organische Phase abgetrennt,
- 20 diese mit Natriumsulfat getrocknet, das Trockenmittel abfiltriert. Nach Einengen erhält man 47.8 g Rohgemisch. Nach säulenchromatographischer Trennung mit Essigester/Heptan als Laufmittel wurden 8.5 g 4-chloro-6-trifluoromethyl-pyrimidin-2-ylamine (fest, 22 % Ausbeute, Reinheit 95 %) erhalten.

- 25 5-Chlor-N4-[(1R,2S)-2,6-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]-6-(trifluoromethyl)pyrimidin-2,4-diamin (Bsp.: I-38)

- Eine Mischung aus 0.10 g (0.43 mmol) 4,5-Dichlor-6-(trifluoromethyl)pyrimidin-2-amin, 0.08 g (0.51 mmol) (1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-amin und
- 30 0.14 g (1.3 mmol) Kaliumcarbonat werden in 1 ml Dimethylacetamid als Lösemittel wird in einem Mikrowellengerät (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>) 30 Minuten auf 125 °C erhitzt.

Das Rohgemisch wird auf Kieselgel aufgezogen und nach säulenchromatographischer Trennung erhält man 0.089 g 5-Chlor-N4-[(1R,2S)-2,6-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]-6-(trifluoromethyl)pyrimidin-2,4-diamin (fest, 55 % Ausbeute, 95 % Reinheit).

5

2-Amino-4-phenyl-6-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-ylamino]pyrimidin-5-carbonitril (Bsp.: I-53)

10 Eine Mischung aus 0.40 g (1.21 mmol) 2-Amino-4-chloro-6-phenylpyrimidin-5-carbonitril (Rohgemisch aus Vorstufe, ca. 70 % Reinheit), 0.27 g (1.82 mmol) (1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-amin und 0.34 g (2.42 mmol) Kaliumcarbonat werden in 1 ml N-Methylpyrrolidon als Lösemittel in einem Mikrowellengerät (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>) 60 Minuten auf 150 °C erhitzt. Das Rohgemisch wird auf Kieselgel aufgezogen und nach säulenchromatographischer Trennung erhält man 0.291 g 2-Amino-4-phenyl-6-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-ylamino]pyrimidin-5-carbonitril (fest, 67 % Ausbeute, 95 % Reinheit).

20 Zu einer Mischung aus 50 ml Phosphoroxychlorid und 0.5 ml Dimethylanilin gibt man portionsweise (jeweils ca. 1 g) 6.6 g (31.1 mmol) 2-Amino-6-oxo-4-phenyl-1,6-dihydropyrimidin-5-carbonitril und erhitzt die Mischung solange zum Rückfluß, bis sich der zugefügte Feststoff gelöst hat. Die Mischung wird anschließend weitere 90 Minuten zum Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen wird die Reaktionsmischung unter Beachtung der Vorsichtsmaßnahmen für Phosphoroxychlorid auf Eiswasser gegeben. Die wässrige Phase wird mit Methylenchlorid extrahiert, die organische Phase abgetrennt, diese mit Natriumsulfat getrocknet, das Trockenmittel abfiltriert. Nach Einengen erhält man 3.2 g 2-Amino-4-chloro-6-phenylpyrimidin-5-carbonitril (fest, ca. 70 % Reinheit, verunreinigt mit 2-Amino-6-oxo-4-phenyl-1,6-dihydropyrimidin-5-carbonitril und Dimethylanilin; das Rohgemisch kann ohne weitere Reinigung in die 30 Folgestufe eingesetzt werden).

Zu einer Mischung aus 80 ml Methanol, 5.5 g (34.5 mmol) Methyl-N-cyanobenzolcarboximidoat und 2.9 g (34.5 mmol) Cyanacetamid tropft man 7.6 ml (7.4 g, Dichte 0.98 g/l, 41.2 mmol) einer kommerziell verfügbaren 30 % Natriummethanolatlösung. Das Reaktionsgemisch erhitzt man 120 Minuten zum Rückfluß, kühlt die Mischung ab, engt ein und nimmt den verbleibenden Rückstand in Wasser auf. Anschließend neutralisiert man die wässrige Phase mit konz. Schwefelsäure und isoliert den ausgefallenen Feststoff. Nach trocknen erhält man 6.78 g 2-Amino-6-oxo-4-phenyl-1,6-dihydropyrimidin-5-carbonitril (fest, ca. 95 % Reinheit).

10 N4-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-5-(trifluoromethyl)pyrimidine-2,4-diamine (Bsp.: 1.60)

Zu einer auf ca. 5 °C gekühlten methanolischen Ammoniaklösung (ca. 8 mol Ammoniak in Methanol) gibt man unter Rühren 1.0 g 2,4-Dichloro-5-(trifluormethyl)pyrimidin, Aldrich Bestell-Nr. 684864, lässt auf 25 °C erwärmen und rührt zwei Stunden bei der Temperatur. Die Mischung wird eingeeengt und auf Wasser gegeben. Nach Absaugen erhält man 0.56 g einer Mischung aus 4-Amino-2-chlor-5-trifluormethylpyrimidin (ca. 45 %) und 2-Amino-4-chlor-5-trifluormethylpyrimidin (ca. 45 %).

20 Anschließend erhitzt man in einer geschlossenen Küvette eine Mischung aus 0.25 g des oben erhaltenen Feststoffes sowie 0.224 g (1.47 mmol) (R)-1,2,3,4-Tetrahydro-1-naphthylamin und 0.35 g (2.53 mmol) Kaliumcarbonat in 1 ml N-Methylpyrrolidon als Lösemittel in einem Mikrowellengerät (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>) 60 Minuten auf 160 °C. Das Rohgemisch wird auf Kieselgel aufgezogen und nach säulenchromatographischer Trennung erhält man 0,190 g N4-[(1R)-1,2,3,4-Tetrahydronaphthalen-1-yl]-5-(trifluoromethyl)pyrimidin-2,4-diamin (wachsartig, 95 % Reinheit).

## Chemisch-physikalische Daten:

Verbindung	Beschreibung
1.4	fest, Smp.: 53 - 55 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.50 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 5.10 - 5.50 (m, 4H, CH, NH, NH <sub>2</sub> ); 5.70 (s, 1H, PYR-H); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.17	fest, Smp.: 184 - 185 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.70 - 2.00 (m, 2 * CH <sub>2</sub> ); 2.20 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.25 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 4.80 - 5.40 (m, 4H, CH, NH <sub>2</sub> , NH); 6.10 (s, 1H, PYR-H); 6.95 (br, 2H, Ar-H)
1.18	fest, Smp.: 134 - 135 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.60 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 5.10 - 5.50 (m, 4H, CH, NH, NH <sub>2</sub> ); 6.10 (s, 1H, PYR-H); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.19	fest, Smp.: 167 - 168 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.60 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 3.70 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.95 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.50 (d, 1H, NH); 5.70 (dd, 1H, CH); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.24	fest, Smp.: 194 - 195 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.70 - 2.00 (m, 2 * CH <sub>2</sub> ); 2.20 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 3.70 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.95 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.30 (br, 1H, CH); 5.50 (d, 1H, NH); 6.95 (br, 2H, Ar-H)
1.25	fest, Smp.: 140 - 142 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.70 - 2.00 (m, 2 * CH <sub>2</sub> ); 2.20 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 5.15 (br, 1H, CH); 5.30 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 6.50 (d, 1H, NH); 6.95 (br, 2H, Ar-H)
1.26	fest, Smp.: 156 - 158 °C; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 300 MHz, δ in ppm): 1.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.00 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.60 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 4.80 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 4.95 (d, 1H, NH); 5.75 (dd, 1H, CH); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.27	fest; logp (HCOOH): 2.77; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.05 (dd, 1H, CH); 4.40 - 6.40 (m, 4H, NH <sub>2</sub> , NH, CH); 6.95 - 7.10 (m, 3H, Ar-H)
1.30	fest; Smp.: 197.7 °C; logp (HCOOH): 1.39; 1H-NMR (DMSO, 400 MHz, δ in ppm): 1.20 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.05 (dd, 1H, CH); 5.20 (t, 1H, CH); 6.25 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 6.40 (t, 1H, CF <sub>2</sub> H); 6.90 - 7.10 (m, 3H, Ar-H); 7.50 (br, 1H, NH);
1.35	fest; logp (HCOOH): 1.18; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 1H von CH <sub>2</sub> , CH <sub>2</sub> ); 2.05 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 4.70 - 5.50 (m, 3H, CH, NH <sub>2</sub> ); 6.00 (br, 1H, NH); 6.20 (t, 1H, CF <sub>2</sub> H); 7.05 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.36	Wachsartig; logp (HCOOH): 1.08; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.65 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 und 2.95 (jeweils m, 2H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 4.70 - 5.50 (m, 3H, CH, NH <sub>2</sub> ); 6.20 (br, 1H, NH); 6.20 (t, 1H, CF <sub>2</sub> H); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.38	fest; Smp.: 169.2 °C; logp (HCOOH): 3.98; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.30 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.10 (dd, 1H, CH); 4.95 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.30 (t, 1H, CH); 5.70 (br, 1H, NH); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H);
1.41	fest; logp (HCOOH): 3.27; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.30 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.55 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.10 (dd, 1H, CH); 3.75 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 5.30 (t, 1H, CH); 5.80 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.70 (br, 1H, NH); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H);
1.42	wachsartig; logp (HCOOH): 2.60; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.00 (dd, 1H, CH); 4.70 - 5.00 (m, 4H, NH <sub>2</sub> , NH, CH); 5.90 (br, 1H, PYR-H); 6.95 - 7.10 (m, 3H, Ar-H);
1.43	wachsartig; logp (HCOOH): 2.16; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 3H von CH <sub>2</sub> ); 2.05 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH); 4.70 - 5.00 (m, 4H, NH <sub>2</sub> , NH, CH); 5.80 (br, 1H, PYR-H); 7.05 - 7.30 (m, 4H, Ar-H);
1.44	wachsartig; logp (HCOOH): 1.95; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.60 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.00 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 4.70 - 5.00 (m, 4H, NH <sub>2</sub> , NH, CH); 5.90 (br, 1H, PYR-H); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H);

Verbindung	Beschreibung
1.45	wachsartig; logp (HCOOH): 2.87; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 1H von CH <sub>2</sub> ; CH <sub>2</sub> ); 2.05 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 4.80 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.35 (t, 1H, CH); 5.50 (br, 1H, NH); 7.05 - 7.30 (m, 4H, Ar-H)
1.47	wachsartig; logp (HCOOH): 3.76; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 3H von CH <sub>2</sub> ); 2.05 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH); 4.95 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.40 (br, 1H, CH); 5.80 (br, H, NH); 7.05 - 7.30 (m, 4H, Ar-H);
1.51	fest; Smp.: 164 - 5 °C; logp (HCOOH): 3.27; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.55 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.10 (dd, 1H, CH); 5,25 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.45 (t, 1H, CH); 5.60 (br, 1H, NH); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H); 7.50 (m, 3H, Ar-H); 7.90 (m, 2H, Ar-H);
1.53	fest; logp (HCOOH): 2.87; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 1H von CH <sub>2</sub> ; CH <sub>2</sub> ); 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 5,25 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.50 (t, 1H, CH); 5.70 (br, 1H, NH); 7.10 - 7.30 (m, 4H, Ar-H); 7.50 (m, 3H, Ar-H); 7.90 (m, 2H, Ar-H);
1.54	wachsartig; logp (HCOOH): 1.71; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.40 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.55 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.10 (dd, 1H, CH); 5,10 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.40 (br, 2H, CH, NH); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H);
1.57	fest, Smp.: 144 - 145 °C; logp (HCOOH): 1.64; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.05 (dd, 1H, CH); 5,00 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.20 (br, 1H, NH); 5.45 (t, 1H, CH); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H); 8,15 (s, 1H, PYR-H)
1.58	fest; logp (HCOOH): 1.49; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 3H von CH <sub>2</sub> ); 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, CH); 4.95 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.20 (br, 1H, CH); 5.50 (br, H, NH); 7.05 - 7.30 (m, 4H, Ar-H); 8.05 (s, 1H, PYR-H);
1.59	wachsartig; logp (HCOOH): 1.16; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 1H von CH <sub>2</sub> ; CH <sub>2</sub> ); 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2,30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.85 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 5,25 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.40 (br, 2H, NH, CH); 7.10 - 7.30 (m, 4H, Ar-H);
1.60	fest, Smp.: 120 - 121 °C; logp (HCOOH): 1.55; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.40 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.55 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.10 (dd, 1H, CH); 5,00 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.35 (t, 1H, CH); 5.60 (br, 1H, NH); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H);
1.62	wachsartig; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 3H, 1H von CH <sub>2</sub> ; CH <sub>2</sub> ); 2.05 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2,35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.85 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 4,70 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.40 (m, 2H, NH, CH); 7.10 - 7.30 (m, 4H, Ar-H);
1.63	fest, logp (HCOOH): 2,54; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.25 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.35 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.50 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.10 (dd, 1H, CH); 4.05 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 5,00 - 5.60 (n, 4H, NH, CH, NH <sub>2</sub> ); 6.80 (br, 1H, PYR-H); 6.95 (s, 1H, Ar-H); 7.05 (dd, 2H, Ar-H);
1.210	fest, Smp.: 168 - 169 °C; logp (HCOOH): 3.41; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.70 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.05 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 4.95 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.65 (br, 1H, CH); 5.75 (br, H, NH); 7.15 - 7.30 (m, 4H, Ar-H);
1.212	wachsartig; logp (HCOOH): 1.64; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.20 (t, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.55 (m, 2H, 2H von CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.15 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> O); 4.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> O); 5.00 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.30 (br, H, NH); 5.45 (br, 1H, CH); 6.80 (d, 1H, Ar-H); 7.00 - 7.10 (m, 2H, Ar-H); 8.10 (s, 1H, PYR-H);
1.213	wachsartig; logp (HCOOH): 1.25; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.35 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.70 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> O); 4.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> O); 5.45 (br, 1H, CH); 5.80 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 6.00 (br, H, NH); 6.60 (s, 1H, Ar-H); 6.85 (m, 2H, Ar-H); 8.00 (s, 1H, PYR-H);
1.215	wachsartig; logp (HCOOH): 2.03; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.35 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 1.40 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.00 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.40 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 5.00 - 5.10 (br, 3H, NH, NH <sub>2</sub> ); 5.55 (br, 1H, CH); 6.80 (d, 1H, Ar-H); 6,95 (d, 1H, Ar-H); 8.10 (s, 1H, PYR-H);

Verbindung	Beschreibung
1.216	wachsartig; logp (HCOOH): 1.66; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 0.90 (d, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.60 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.05 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 5.15 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.25 (br, H, NH); 5.80 (br, 1H, CH); 6.85 – 7.00 (m, 2H, Ar-H); 7.15 (m, 1H, Ar-H); 8.10 (s, 1H, PYR-H);
1.218	wachsartig; logp (HCOOH): 1.60; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 2.00 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.65 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.05 (dd, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 5.05 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.20 (br, H, NH); 5.75 (br, 1H, CH); 7.15 – 7.30 (m, 3H, Ar-H); 8.10 (s, 1H, PYR-H);
1.220	wachsartig; logp (HCOOH): 1.48; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.90 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.30 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.70 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.00 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 5.70 – 6.00 (m, 4H, NH <sub>2</sub> , NH, CH); 7.05 – 7.30 (m, 3H, Ar-H); 7.95 (s, 1H, PYR-H);
1.223	wachsartig; logp (HCOOH): 1.78; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.20 – 2.10 (m, 14H); 2.50 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.80 (m, 2H, 2H von CH <sub>2</sub> ); 4.85 (m, 1H, 1H von CHO); 5.00 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.50 (br, 1H, CH); 7.05 – 7.30 (m, 4H, Ar-H); 8.70 (br, 1H, NH);
1.224	fest; logp (HCOOH): 3.83;
1.225	wachsartig; logp (HCOOH): 3.83; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.80 (m, 3H, 3H von CH <sub>2</sub> ); 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 (m, 2H, 2H von CH <sub>2</sub> ); 3.90 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.80 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.45 (br, 1H, CH); 5.50 (br, 1H, NH); 7.05 – 7.30 (m, 4H, Ar-H);
1.225	fest, Smp.: 150 – 151 °C; logp (HCOOH): 0.83;
1.226	wachsartig; logp (HCOOH): 1.48;
1.256	wachsartig; logp (HCOOH): 3.56; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.65 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.00 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 3.90 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.80 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.60 (br, 1H, NH); 5.65 (br, 1H, CH); 7.15 – 7.35 (m, 4H, Ar-H);
1.257	wachsartig; logp (HCOOH): 3.90; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.15 (t, 3H, CH <sub>3</sub> ); 2.10 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.20 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.55 (q, 2H, 2H von CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.90 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.15 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> O); 4.25 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> O); 4.85 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.35 (br, 1H, CH); 5.55 (br, H, NH); 6.75 (d, 1H, Ar-H); 7.00 (d, 2H, Ar-H);
1.259	wachsartig; logp (HCOOH): 4.59; 1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , 400 MHz, δ in ppm): 1.20 (d, 6H, 2*CH <sub>3</sub> ); 1.85 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.65 (m, 1H, 1H von CH <sub>2</sub> ); 2.80 – 3.00 (m, 3H, 1H von CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 2H von CH <sub>2</sub> ); 4.85 (br, 2H, NH <sub>2</sub> ); 5.55 (br, H, NH); 5.70 (br, 1H, CH); 7.15 – 7.35 (m, 3H, Ar-H);

## B. Formulierungsbeispiele

- 5 a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsul-
- 10

fonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoymethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

- 5 c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykoether (®Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykoether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277 C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- 10 d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- 15 e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man 75 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Calcium, 5 Gew.-Teile Natriumlaurylsulfat, 3 Gew.-Teile Polyvinylalkohol und
- 20 7 Gew.-Teile Kaolin mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.
- 25 f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man 25 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 5 Gew.-Teile 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium 2 Gew.-Teile oleoymethyltaurinsaures Natrium, 1 Gew.-Teil Polyvinylalkohol, 17 Gew.-Teile Calciumcarbonat und
- 30 50 Gew.-Teile Wasser

auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

## 5 C. Biologische Beispiele

### Versuchsbeschreibung

#### 1. Herbizide Wirkung bzw. Kulturpflanzenverträglichkeit im Voraufbau

10 Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen werden in Holzfaser-töpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha unter Zusatz von  
15 0,2% Netzmittel auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Testpflanzen gehalten. Die visuelle Bonitur der Schäden an den Versuchspflanzen erfolgt nach einer Versuchszeit von 3 Wochen im  
20 Vergleich zu unbehandelten Kontrollen (herbizide Wirkung in Prozent (%): 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0 % Wirkung = wie Kontrollpflanzen).

In den nachfolgenden Tabellen werden folgende Abkürzungen verwendet:

ABUTH:	<i>Abutilon theophrasti</i>	ALOMY:	<i>Alopecurus myosuroides</i>
25 AMARE:	<i>Amaranthus retroflexus</i>	CHEAL:	<i>Chenopodium album</i>
CYPES:	<i>Cyperus esculentus</i>	ECHCG:	<i>Echinochloa crus-galli</i>
LOLMU:	<i>Lolium multiflorum</i>	MATIN:	<i>Matricaria inodora</i>
POLCO:	<i>Polygonum convolvulus</i>	PHBPU:	<i>Pharbitis purpurea</i>
SETVI:	<i>Setaria viridis</i>	STEME:	<i>Stellaria media</i>
30 VERPE:	<i>Veronica persica</i>	VIOTR:	<i>Viola tricolor</i>

Tabelle 1: Herbizide Wirkung im Voraufbau

Beispiel Nr.	Dosierung	ALOMY	AMARE	CYPES	ECHCG	LOLMU	MATIN	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR
1.18	320		100					100			100	
1.17	320		100								100	
1.31	320	100		100		80		100	100			
1.27	320		100		100	80	100	100	100	100	100	100
1.30	320	100	100		100	100	100	100	100	100	100	100
1.35	320	80	100		80	100		100	90		100	100
1.42	320	100	100		100		100	100	100	100	100	100
1.44	320		100					100			100	100

Wie die Ergebnisse zeigen, weisen erfindungsgemäße Verbindungen eine gute herbizide Voraufbauwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise haben die Verbindungen aus Tabelle 1 sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie *Stellaria media*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Amaranthus retroflexus* und *Alopecurus myosuroides* im Voraufbauverfahren bei einer Aufwandmenge von 0.32 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

10

## 2. Herbizide Wirkung bzw. Kulturpflanzenverträglichkeit im Nachaufbau

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen werden in Holzfaser-töpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. 2 bis 3 Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Einblattstadium behandelt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha unter Zusatz von 0,2% Netzmittel auf die grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach ca. 3 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen wird die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert (herbizide Wirkung in Prozent (%): 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0 % Wirkung = wie Kontrollpflanzen).

20

Tabelle 2: Herbizide Wirkung im Nachauflauf

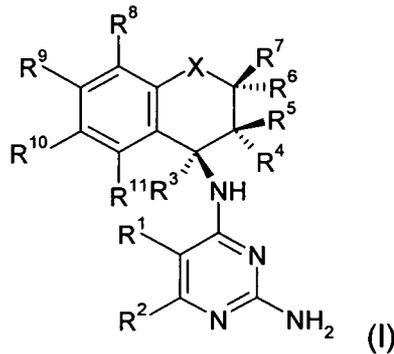
Beispiel Nr.	Dosierung	ABUTH	AMARE	CHEAL	ECHCG	LOLMU	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR
1.31	320	90	100	80			90					90	
1.27	320	90	100		85			85	80	80		85	85
1.30	320	85	95		87	80		90		80	80	90	85
1.35	320		90					80					80
1.36	320	80	100		90	90		80				90	90
1.42	320		100		90			100	80	80		80	90

Wie die Ergebnisse zeigen, weisen erfindungsgemäße Verbindungen eine gute herbizide Nachauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise haben die Verbindungen aus Tabelle 2 sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie *Echinochloa crus-galli*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* im Nachauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0.32 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

## Patentansprüche:

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren agrochemisch-verträglichen Salze,

5



in welchen

10

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup>, unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus

15

- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, Nitro, Amino, C(O)OH, C(O)NH<sub>2</sub>;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyloxycarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenyloxycarbonyl;

20

- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkinyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyloxycarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkinyloxycarbonyl;
- Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl, Mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl, Phenylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl;
- (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylcarbonyl und (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxycarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und/oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl-carbonyloxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxycarbonyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxycarbonyloxy;
- Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino, Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino, ((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkanoyl)-amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkanoyl)-amino, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl;
- Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino-carbonyl, Mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino-carbonyl, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl)-amino-carbonyl, Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino-carbonyl, ((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl)-amino-carbonyl, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkanoyl)-amino-carbonyl, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkanoyl)-amino-carbonyl;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy;
- (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, welches gegebenenfalls am Cycloalkylrest durch (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylcarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxycarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkylcarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxycarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxycarbonyl, (C<sub>3</sub>-

- C<sub>8</sub>)-Cycloalkylcarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxycarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-  
 Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 halogenalkylcarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alkoxy carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxycarbonyloxy;
- 5 - (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-  
 Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 halogenalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylcarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-  
 oxycarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-  
 10 Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkylcarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)-alkoxycarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxycarbonyl,  
 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylcarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyloxycarbonyloxy,  
 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenalkylcarbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy-  
 15 carbonyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkoxycarbonyloxy;
- Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy Cyano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy,  
 Cyano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 Haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 20 Halogenalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halo-  
 alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 Haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl,  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 25 haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 Haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkylsulfonyloxy,  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 Alkylthiocarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylthiocarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 30 Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-  
 thio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylcarbonyloxy,  
 (C<sub>4</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylsulfonyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylthio, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-

Cycloalkylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynylthio;

- die Reste R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen eine (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylengruppe bilden, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten können, wobei die (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können;

R<sup>3</sup> ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl;

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup>, jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy; oder zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an welchem sie gebunden sind, einen drei- bis siebengliedrigen Ring bilden;

R<sup>6</sup> und

R<sup>7</sup>, jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxy, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Arylcarbonyl und (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryloxycarbonyl; oder die Reste R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> zusammen eine (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe bilden, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten können, wobei die (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können,

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup>, unabhängig voneinander, jeweils ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyloxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Di-Alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl,

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkynylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkinyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyloxycarbonyl und (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Halogenalkinyloxycarbonyl; und

5

X für eine Bindung, CH<sub>2</sub>, O, S, Carbonyl, NH, CR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> und NR<sub>14</sub> steht,

R<sup>12</sup> R<sup>13</sup> jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl,

10

R<sup>14</sup> ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl,

15

a) mit der Maßgabe, dass mindestens ein Rest von R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> oder R<sup>11</sup> ungleich Wasserstoff ist, wenn R<sup>2</sup> gleich CF<sub>3</sub> ist,

b) R<sup>2</sup> nicht Chlor bedeutet, wenn R<sup>1</sup> für NH<sub>2</sub> steht.

20

2. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest R<sup>1</sup> ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, C(=O)NH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cyclopropyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Thioalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, Mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino und Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylsilyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alkynyl.

25

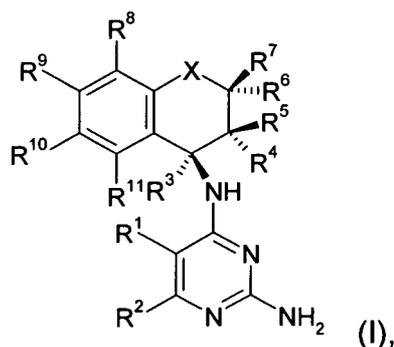
3. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest R<sup>2</sup> ausgewählt wird aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylphenyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl, welches am Arylrest durch (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Haloalkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; C<sub>6</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, welches am Cycloalkylrest durch (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Haloaryl und/oder Halogen substituiert sein kann; 1-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylcyclopropyl, 1-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-C<sub>6</sub>-

30

aryl)-cyclopropyl, 1-(Monohalogenphenyl)-cyclopropyl, 1-(Dihalogenphenyl)-cyclopropyl, Mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Thioalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy und Amino.

- 5 4. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an welche sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, welcher durch ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus Sauerstoff und Schwefel, unterbrochen sein kann;
- 10 5. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest R<sup>3</sup> Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl ist.
- 15 6. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass die Reste R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup>, jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt werden aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Hydroxy, Cyclopropyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy.
- 20 7. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass die Reste R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> zusammen eine (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe bilden, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten können, wobei die (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können.
- 25 8. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, dass die Reste R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup>, unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl und (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-Aryl.
- 30

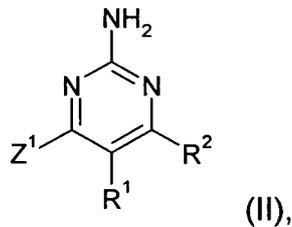
9. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest  $R^8$  ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl und Halogen.
- 5 10. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest  $R^9$  bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und  $(C_1-C_6)$ -Alkyl.
- 10 11. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 10, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest  $R^{10}$  ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl, Di- $(C_1-C_6)$ -alkylamino, Halogen,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkynyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_2-C_6)$ -alkinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy- $(C_1-C_6)$ -alkyl- $(C_2-C_6)$ -alkinyl, Cyano,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxycarbonyl und Aminocarbonyl.
- 15 12. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 11, dadurch gekennzeichnet, dass  $R^{11}$  ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und  $(C_1-C_6)$ -Alkyl.
- 20 13. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 12, dadurch gekennzeichnet, dass X ausgewählt wird aus der Gruppe, bestehend aus  $CH_2$ , O und einer chemischen Bindung.
- 25 14. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



worin die Reste  $R^1$  bis  $R^{11}$  und X die Bedeutungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 13 aufweisen, dadurch gekennzeichnet, dass

(1) eine Verbindung der allgemeinen Formel (II)

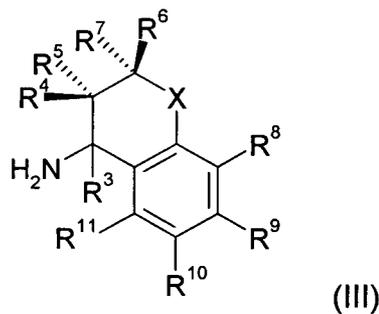
5



worin  $R^1$  und  $R^2$  eine Bedeutung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 aufweist und  $Z^1$  einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, wie insbesondere Chlor, Trichlormethyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfonyl, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl- $(C_1-C_4)$ -alkylsulfonyl oder  $(C_1-C_4)$ -Alkylphenylsulfonyl, bedeutet, mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz davon

10

15



umsetzt.

20 15. Herbizides oder pflanzenwachstumsregulierendes Mittel, dadurch gekennzeichnet, dass es eine oder mehrere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 13 enthält.

16. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine wirksame Menge von einer oder mehreren Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salzen nach einem der Ansprüche 1 bis 13 auf Pflanzen, Pflanzenteile, Pflanzensamen oder auf eine Anbaufläche appliziert.
- 5
17. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salzen nach einem der Ansprüche 1 bis 13 als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.
- 10
18. Verwendung nach Anspruch 17, dadurch gekennzeichnet, dass die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen in Kulturen von Nutz- oder Zierpflanzen eingesetzt werden.
- 15
19. Verwendung nach Anspruch 18, dadurch gekennzeichnet, dass die Kulturpflanzen transgene Kulturpflanzen sind.
20. Verwendung nach Anspruch 18 oder 19, dadurch gekennzeichnet, dass die Kulturpflanzen aus Plantagenkulturen ausgewählt sind.
- 20

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No  
PCT/EP2009/009287

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
 INV. C07D239/48 C07D239/50 C07D405/12 A01N43/54

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 A01N

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)  
 EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 523 533 A (BASF AG [DE]) 20 January 1993 (1993-01-20) cited in the application page 3, line 1 - line 50; claim 1; compound 3.07	1-20
A	WO 2004/069814 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; DIETRICH HANSJOERG []) 19 August 2004 (2004-08-19) cited in the application page 1, line 4 - line 6; claim 1	1-20
A	WO 2008/043031 A (PHARMACOPEIA INC [US]; NEAGU IRINA [US]; DILLER DAVID [US]; KINGSBURY) 10 April 2008 (2008-04-10) page 71	1,3,5,6, 8-13

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

\* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  22 Februar 2010	Date of mailing of the international search report  02/03/2010
--	--

Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer  Seelmann, Ingo
--	--

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2009/009287

Patent document cited in search report	A	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0523533	A	20-01-1993	CA	2073883 A1	17-01-1993
			DE	4123525 A1	21-01-1993
			HU	62758 A2	28-06-1993
			JP	5202000 A	10-08-1993
			US	5280009 A	18-01-1994
WO 2004069814	A	19-08-2004	AP	1960 A	28-02-2009
			AU	2004208875 A1	19-08-2004
			BR	PI0407251 A	31-01-2006
			CA	2515116 A1	19-08-2004
			EC	SP055934 A	22-11-2005
			HR	20050702 A2	31-07-2006
			JP	2006517547 T	27-07-2006
			KR	20050098894 A	12-10-2005
			MX	PA05008295 A	20-09-2005
			US	2004157739 A1	12-08-2004
WO 2008043031	A	10-04-2008	AR	063142 A1	30-12-2008
			CL	28662007 A1	04-07-2008
			US	2008214580 A1	04-09-2008

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2009/009287

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> INV. C07D239/48 C07D239/50 C07D405/12 A01N43/54		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b>		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole ) C07D A01N		
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, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 523 533 A (BASF AG [DE]) 20. Januar 1993 (1993-01-20) in der Anmeldung erwähnt Seite 3, Zeile 1 - Zeile 50; Anspruch 1; Verbindung 3.07	1-20
A	WO 2004/069814 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; DIETRICH HANSJOERG [ ]) 19. August 2004 (2004-08-19) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 4 - Zeile 6; Anspruch 1	1-20
A	WO 2008/043031 A (PHARMACOPEIA INC [US]; NEAGU IRINA [US]; DILLER DAVID [US]; KINGSBURY) 10. April 2008 (2008-04-10) Seite 71	1,3,5,6, 8-13
<input 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		"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
"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
"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)		"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht		"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche  <b>22. Februar 2010</b>		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts  <b>02/03/2010</b>
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  <b>Seelmann, Ingo</b>

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2009/009287

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung		
EP 0523533	A	20-01-1993	CA	2073883 A1	17-01-1993		
			DE	4123525 A1	21-01-1993		
			HU	62758 A2	28-06-1993		
			JP	5202000 A	10-08-1993		
			US	5280009 A	18-01-1994		
WO 2004069814	A	19-08-2004	AP	1960 A	28-02-2009		
			AU	2004208875 A1	19-08-2004		
			BR	PI0407251 A	31-01-2006		
			CA	2515116 A1	19-08-2004		
			EC	SP055934 A	22-11-2005		
			HR	20050702 A2	31-07-2006		
			JP	2006517547 T	27-07-2006		
			KR	20050098894 A	12-10-2005		
			MX	PA05008295 A	20-09-2005		
			US	2004157739 A1	12-08-2004		
WO 2008043031	A	10-04-2008	AR	063142 A1	30-12-2008		
			CL	28662007 A1	04-07-2008		
			US	2008214580 A1	04-09-2008		