

(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
25. November 2010 (25.11.2010)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2010/133312 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 213/56 (2006.01) A01N 43/40 (2006.01)
C07D 231/14 (2006.01) A01N 43/56 (2006.01)
C07D 239/36 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
C07D 277/56 (2006.01) A01N 43/54 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) A61P 33/00 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01) A61K 31/381 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2010/002944

(22) Internationales Anmeldedatum:
12. Mai 2010 (12.05.2010)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
09160715.0 20. Mai 2009 (20.05.2009) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MAUE, Michael [DE/DE]; Goethestrasse 21, 40764 Langenfeld (DE). ADELT, Isabelle [FR/DE]; Bettina-von-Arnim Str. 3, 42781 Haan (DE). GIENCKE, Wolfgang [DE/DE]; Am Steinberg 45, 65719 Hofheim (DE). HEIL, Markus [DE/DE]; Am Weissen Stein 43a, 42799 Leichlingen (DE). JESCHKE, Peter [DE/DE]; Kalmüntener Strasse 44a, 51467 Ber-

gisch Gladbach (DE). KAPFERER, Tobias [DE/DE]; Schlossstr. 5, 40477 Düsseldorf (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am Vorend 52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). MÜHLTAU, Friedrich, August [AT/DE]; Nordstrasse 47, 50733 Köln (DE). SUDAU, Alexander [DE/DE]; Brucher Weg 5a, 42799 Leichlingen (DE). ADAMCZEWSKI, Martin [DE/DE]; Andersenstr. 22, 51067 Köln (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestr. 38, 40764 Langenfeld (DE). EBBINGHAUS-KINTSCHER, Ulrich [DE/DE]; Wittbräucker Str. 122, 44287 Dortmund (DE). RAMING, Klaus [DE/DE]; Lortzingstr. 35, 51375 Leverkusen (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Mozartstrasse 3-5, 50674 Köln (DE). FRANKEN, Eva-Maria [DE/FR]; 422 Route de Bellevue, 69760 Limonest (FR). BECKER, Angela [DE/DE]; Stratenweg 45, 40629 Düsseldorf (DE). GÖRGENS, Ulrich [DE/DE]; Fester Str. 37, 40882 Ratingen (DE).

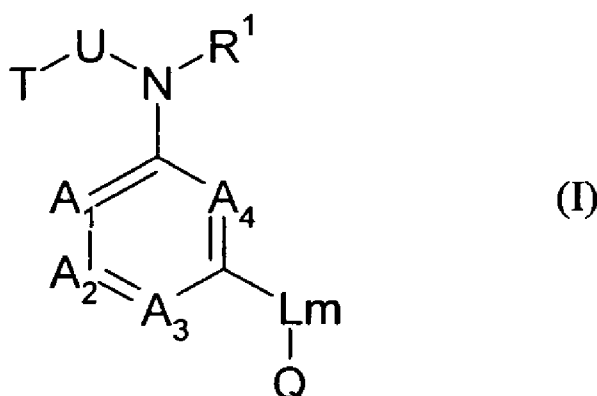
(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Business Planning and Administration, Law and Patents, Patents and Licensing, Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(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,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: HALOGEN-SUBSTITUTED COMPOUNDS AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung : HALOGEN-SUBSTITUIERTE VERBINDUNGEN ALS PESTIZIDE



(57) Abstract: The invention relates to compounds of the general formula (I) in which the radicals A₁, A₂, A₃, A₄, Lm, Q, R¹, T and U have the meanings given in the description, and to the use of the compounds for controlling animal pests. The invention furthermore relates to processes and intermediates for the preparation of the compounds of the formula (I).

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welcher die Reste A₁, A₂, A₃, A₄, Lm, Q, R¹, T und U die in der Beschreibung angegebene Bedeutung besitzen sowie die Verwendung der Verbindungen zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen. Ferner betrifft die Erfindung Verfahren und Intermediate zur Herstellung der Verbindungen gemäß Formel (I).

WO 2010/133312 A1



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.

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).

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY,

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)

HALOGEN-SUBSTITUIERTE VERBINDUNGEN ALS PESTIZIDE

Die vorliegende Anmeldung betrifft neue Halogen-substituierte Verbindungen, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vor allem von Arthropoden und insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Nematoden.

- 5 Bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen mit insektizider Wirkung sind bereits beschrieben (WO2008/031534; WO2008/074427; WO2008/000438; WO2007/128410; WO2007/051560; WO2008/012027; WO2006/137376).

Ferner ist bekannt, dass bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen herbizid wirksam (vgl. J. Org. Chem. 1997, 62(17), 5908-5919, J. Heterocycl. Chem. 1998, 35(6), 1493-1499, WO
10 2004/035545, WO 2004/106324, US 2006/069132, WO 2008/029084) oder fungizid wirksam sind und zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten eingesetzt werden können (vgl. WO 2009/028280).

Darüber hinaus ist bekannt, dass bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen Cytokin-inhibitorische Aktivitäten aufweisen (WO2006/067445; WO2006/067446; WO2000/007980).

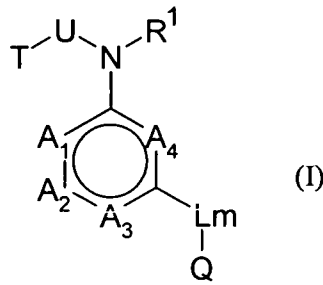
Über die Verwendung der in dieser Anmeldung beanspruchten Halogen-substituierten
15 Verbindungen zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere als Pflanzenschutzmittel, ist jedoch nichts bekannt.

Moderne Pflanzenschutzmittel müssen vielen Anforderungen genügen, beispielsweise in Bezug auf Höhe, Dauer und Breite ihrer Wirkung und möglichen Verwendung. Es spielen Fragen der Toxizität, der Kombinierbarkeit mit anderen Wirkstoffen oder Formulierungsmitteln eine Rolle
20 sowie die Frage des Aufwands, der für die Synthese eines Wirkstoffs betrieben werden muss. Ferner können Resistenzen auftreten. Aus all diesen Gründen kann die Suche nach neuen Pflanzenschutzmitteln nie als abgeschlossen betrachtet werden und es besteht ständig Bedarf an neuen Verbindungen mit gegenüber den bekannten Verbindungen zumindest in Bezug auf einzelne Aspekte verbesserten Eigenschaften.

25 Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, Verbindungen bereitzustellen, durch die das Spektrum der Schädlingsbekämpfungsmittel unter verschiedenen Aspekten verbreitert wird.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen, sowie deren N-Oxide und Salze biologische Eigenschaften aufweisen und sich insbesondere zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen eignen, und deshalb besonders gut im agrochemischen
30 Bereich und im Bereich der Tiergesundheit einsetzbar sind.

Die erfindungsgemäßen Halogen-substituierten Verbindungen sind durch die Formel (I)



definiert, in der

- 5 R^1 für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Alkylen, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_7 -Cycloalkyl, $(C_1$ - C_6 -Alkyl)carbonyl, $(C_1$ - C_6 -Alkoxy)carbonyl, $(C_1$ - C_2 -Alkoxy)-(C_1 - C_2 -alkyl), Cyan-(C_1 - C_2 -alkyl), Aryl-(C_1 - C_3 -alkyl), Heteroaryl-(C_1 - C_3 -alkyl) steht,

die chemischen Gruppierungen

- 10 A_1 für CR^2 , einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel oder eine Bindung,
- A_2 für CR^3 oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,
- A_3 für CR^4 oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel und
- 15 A_4 für CR^5 oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A_1 bis A_4 gleichzeitig für Stickstoff stehen;

- 20 R^2 , R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, CN, NO_2 , gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogenycycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, N -(C_1 - C_6 -Alkyl)amino, N,N -Di-(C_1 - C_6 -alkyl)amino, N -(C_1 - C_6 -Alkyl)aminocarbonyl, N -(C_3 - C_7 -Cycloalkyl)aminocarbonyl oder $(C_1$ - C_4 -
- 25 Alkoxy)carbonyl, stehen;

wenn keine der Gruppierungen A_2 und A_3 für Stickstoff steht, können R^3 und R^4 gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält und gegebenenfalls substituiert ist, oder

5 wenn keine der Gruppierungen A_1 und A_2 für Stickstoff steht, können R^2 und R^3 gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome enthält und gegebenenfalls substituiert ist;

G für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkynyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogencycloalkyl und gegebenenfalls mit
10 R^{14} substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

U für eine Gruppierung $C(=W)$, SO oder SO_2 steht,

wobei

W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den
15 Gruppierungen, $-CH_2NHC(=W)-$, $-CH_2NR^6C(=W)-$, $-C(=W)NH-$, $-C(=W)NR^6$,
 $-C(=W)NHCH_2-$, $-C(=W)NR^6CH_2-$, $-CH=N-OCH_2C(=W)NH-$, $-CH=N-$
 $OCH_2C(=W)NR^6-$, $-CH_2NHC(=W)NH-$, $-CH_2NHC(=W)NR^6-$, $-NHC(=W)NH-$,
 $-NHC(=W)NR^6-$, $-NR^6C(=W)NH-$, $-NR^6C(=W)NR^6-$, $-C(=W)-$, $-C(=W)O-$,
20 $-C(=W)OCH_2C(=W)-$, $-C(=W)OCH_2C(=W)NR^6-$, $-C(=W)OCH_2C(=W)NHC(=W)NH-$,
 $-C(=W)OCH_2C(=W)NH-$, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_3-$, $-Si-$, $-O-$, $-S(O)_p-$, und $-CH_2-S(O)_p-$,
 $-SO(=NH)-$, $-SO(=N-CN)-$ und $-S(=N-CN)-$, $-C(=W)NHSO_2-$, bei der die rechte Seite
der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,

p die Werte 0, 1 oder 2 annehmen kann;

R^6 für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, Aryl- $(C_1$ -
25 C_3 -alkyl), Heteroaryl- $(C_1$ - C_3 -alkyl), C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, $(C_1$ -
 C_2 -Alkyl)- $(C_3$ - C_5 -cycloalkyl), $(C_3$ - C_5 -Cycloalkyl)- $(C_1$ - C_2 -alkyl), $(C_1$ - C_6 -Alkyl)carbonyl
und $(C_1$ - C_6 -Alkoxy)carbonyl steht;

m die Werte 0 oder 1 annehmen kann;

Q für einen gegebenenfalls mehrfach mit V substituierten gesättigten oder ungesättigten 5-
30 oder 6-gliedrigen Ring steht, oder für einen gegebenenfalls mehrfach substituierten 5- oder
6-gliedrigen, heterozyklischen Ring steht, wobei

V für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino steht

die chemische Gruppierung T für einen gegebenenfalls mehrfach mit Z substituierten gesättigten oder ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen Ring steht, oder für einen gegebenenfalls mehrfach mit Z substituierten 5- oder 6-gliedrigen, heterozyklischen Ring steht;

Z für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, -C(=W)NR⁷R⁶, -C(=W)OR⁸, -S(O)₂NR⁹R¹⁰, -S(O)_pR¹¹, -S(O)(=NR¹²)R¹³, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₃-alkyl), Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl) und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

R⁷ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;

~~20~~ R⁸ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);

25 R⁹ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;

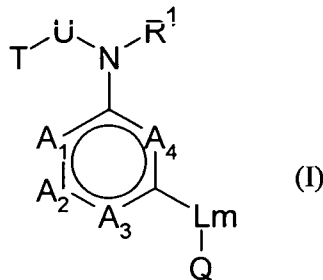
30 R¹⁰ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁵ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);

R¹¹ ausgewählt ist aus den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), C₁-C₄-Haloalkyl;

- R¹² ausgewählt ist aus Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 5 R¹³ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl);
- 10 R¹⁴ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆)alkylamino, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl;
- 15 R¹⁵ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁷ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, -CN, -NO₂ sowie gegebenenfalls mit R¹⁶ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- 20 R¹⁶ ausgewählt ist aus Halogen, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, oder gegebenenfalls mit R¹⁸ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- 25 R¹⁷ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂ oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆)alkylamino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, wobei,
- 30 R¹⁸ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆)alkylamino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl; oder

L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I)



5 .

definiert, in denen

R¹ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₂-Alkoxy)-(C₁-C₂-alkyl), Cyan-(C₁-C₂-alkyl), Aryl(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl(C₁-C₃-alkyl) steht,

10 die chemischen Gruppierungen

A₁ für CR², einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel oder eine Bindung,

A₂ für CR³ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

15 A₃ für CR⁴ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel und

A₄ für CR⁵ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A₁ bis A₄ gleichzeitig für Stickstoff
20 stehen;

R², R³, R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, CN, NO₂, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl,
25 C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)amino, N,N-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, N-(C₁-

C₆-Alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Cycloalkyl)aminocarbonyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, stehen;

5 wenn keine der Gruppierungen A₂ und A₃ für Stickstoff steht, können R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält, oder

wenn keine der Gruppierungen A₁ und A₂ für Stickstoff steht, können R² und R³ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome enthält;

10 G für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

U für eine Gruppierung C(=W), SO oder SO₂ steht,

wobei

15 W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den Gruppierungen -CH₂NHC(=W)-, -CH₂NR⁶C(=W)-, -C(=W)NH-, -C(=W)NR⁶, -C(=W)NHCH₂-, -C(=W)NR⁶CH₂-, -CH=N-OCH₂C(=W)NH-, -CH=N-OCH₂C(=W)NR⁶-, -CH₂NHC(=W)NH-, -CH₂NHC(=W)NR⁶-, -NHC(=W)NH-, -NHC(=W)NR⁶-, -NR⁶C(=W)NH-, -NR⁶C(=W)NR⁶-, -C(=W)-, -C(=W)O-, -C(=W)OCH₂C(=W)-, -C(=W)OCH₂C(=W)NR⁶-, -C(=W)OCH₂C(=W)NHC(=W)NH-, -C(=W)OCH₂C(=W)NH-, -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -Si-, -O-, -S(O)_p-, und -CH₂-S(O)_p-, -SO(=N-CN)- und -S(=N-CN)-, -C(=W)NHSO₂-, bei der die rechte Seite der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,

25 p die Werte 0, 1 oder 2 annehmen kann;

R⁶ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl), C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl steht;

30 m den Wert 1 annimmt;

Q für ein gegebenenfalls mehrfach mit V substituiertes Phenyl, Pyridazin, Pyrazin, Pyrimidin, Triazin, Pyridin, Pyrazol, Thiazol, Isothiazol, Oxazol, Isoxazol, Triazol, Imidazol, Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxadiazol, Thiadiazol steht, wobei

V für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino steht;

die chemische Gruppierung T für ein gegebenenfalls mehrfach mit Z substituiertes Pyridazin, Pyrazin, Pyrimidin, Triazin, Pyridin, Pyrazol, Thiazol, Isothiazol, Oxazol, Isoxazol, Triazol, Imidazol, Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxidiazol oder Thiadiazol stehen kann,

Z für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, -C(=W)NR⁷R⁶, -C(=W)OR⁸, -S(O)₂NR⁹R¹⁰, -S(O)_pR¹¹, -S(O)(=NR¹²)R¹³, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₃-alkyl), Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl) und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

R⁷ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;

R⁸ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);

R⁹ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;

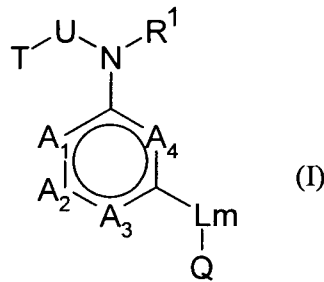
R¹⁰ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁵ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);

- R¹¹ ausgewählt ist aus den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), C₁-C₄-Haloalkyl;
- 5 R¹² ausgewählt ist aus Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- R¹³ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl);
- 10 R¹⁴ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl;
- 15 R¹⁵ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁷ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, -CN, -NO₂ sowie gegebenenfalls mit R¹⁶ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- ~~20 R¹⁶ ausgewählt ist aus Halogen, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, oder gegebenenfalls mit R¹⁸ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;~~
- 25 R¹⁷ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂ oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, wobei,
- 30 R¹⁸ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)amino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-

Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl; oder

L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2
5 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I)



definiert, in denen

R¹ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkynyl,
10 C₃-C₇-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₂-Alkoxy)-(C₁-C₂-alkyl), Cyan-(C₁-C₂-alkyl), Aryl(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl(C₁-C₃-alkyl) steht,

die chemischen Gruppierungen

~~A₁ für CR², einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel oder eine Bindung,~~

15 A₂ für CR³ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

A₃ für CR⁴ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel und

20 A₄ für CR⁵ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A₁ bis A₄ gleichzeitig für Stickstoff stehen;

R², R³, R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, CN, NO₂, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-

- Halogenycycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)amino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, *N*-(C₃-C₆-Cycloalkyl)aminocarbonyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, stehen;
- 5 wenn keine der Gruppierungen A₂ und A₃ für Stickstoff steht, können R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält, oder
- 10 wenn keine der Gruppierungen A₁ und A₂ für Stickstoff steht, können R² und R³ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome enthält;
- G für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;
- 15 U für eine Gruppierung C(=W), SO oder SO₂ steht,
- wobei
- W für Sauerstoff oder Schwefel steht;
- L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den
- 20 Gruppierungen -CH₂NHC(=W)-, -CH₂NR⁶C(=W)-, -C(=W)NH-, -C(=W)NR⁶, -C(=W)NHCH₂-, -C(=W)NR⁶CH₂-, -CH=N-OCH₂C(=W)NH-, -CH=N-OCH₂C(=W)NR⁶-, -CH₂NHC(=W)NH-, -CH₂NHC(=W)NR⁶-, -NHC(=W)NH-, -NHC(=W)NR⁶-, -NR⁶C(=W)NH-, -NR⁶C(=W)NR⁶-, -C(=W)-, -C(=W)O-, -C(=W)OCH₂C(=W)-, -C(=W)OCH₂C(=W)NR⁶-, -C(=W)OCH₂C(=W)NHC(=W)NH-,
- 25 -C(=W)OCH₂C(=W)NH-, -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -Si-, -O-, -S(O)_p-, und -CH₂-S(O)_p-, -SO(=N-CN)- und -S(=N-CN)-, -C(=W)NHSO₂-, bei der die rechte Seite der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,
- p die Werte 0, 1 oder 2 annehmen kann;
- R⁶ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl), C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-
- 30

cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl steht;

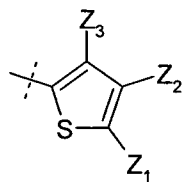
m den Wert 1 annimmt;

Q für ein gegebenenfalls mehrfach mit V substituiertes Phenyl, Pyridin, Oxadiazol, Oxazol,
5 Isoxazol, Pyrazol, Thiazol, Thiadiazol, Triazol steht, wobei

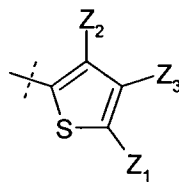
V für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, N,N-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino steht,

10

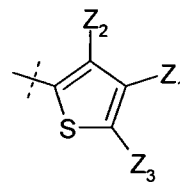
T für einen der unten dargestellten Reste (T-1) – (T-56) stehen kann,



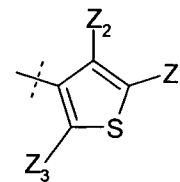
(T-1)



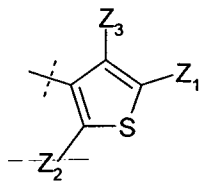
(T-2)



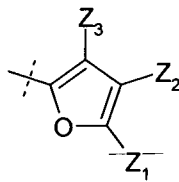
(T-3)



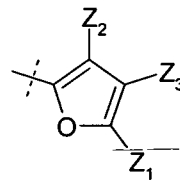
(T-4)



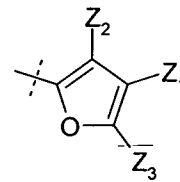
(T-5)



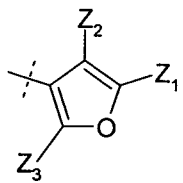
(T-6)



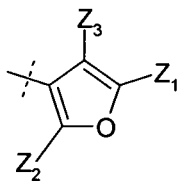
(T-7)



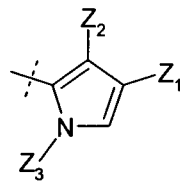
(T-8)



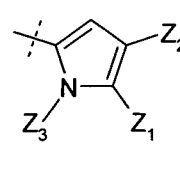
(T-9)



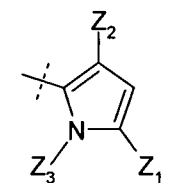
(T-10)



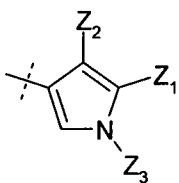
(T-11)



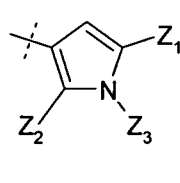
(T-12)



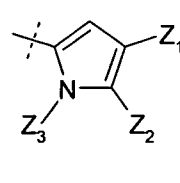
(T-13)



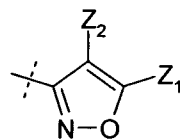
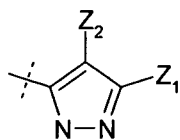
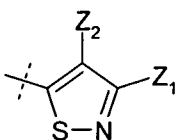
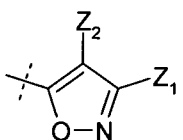
(T-14)

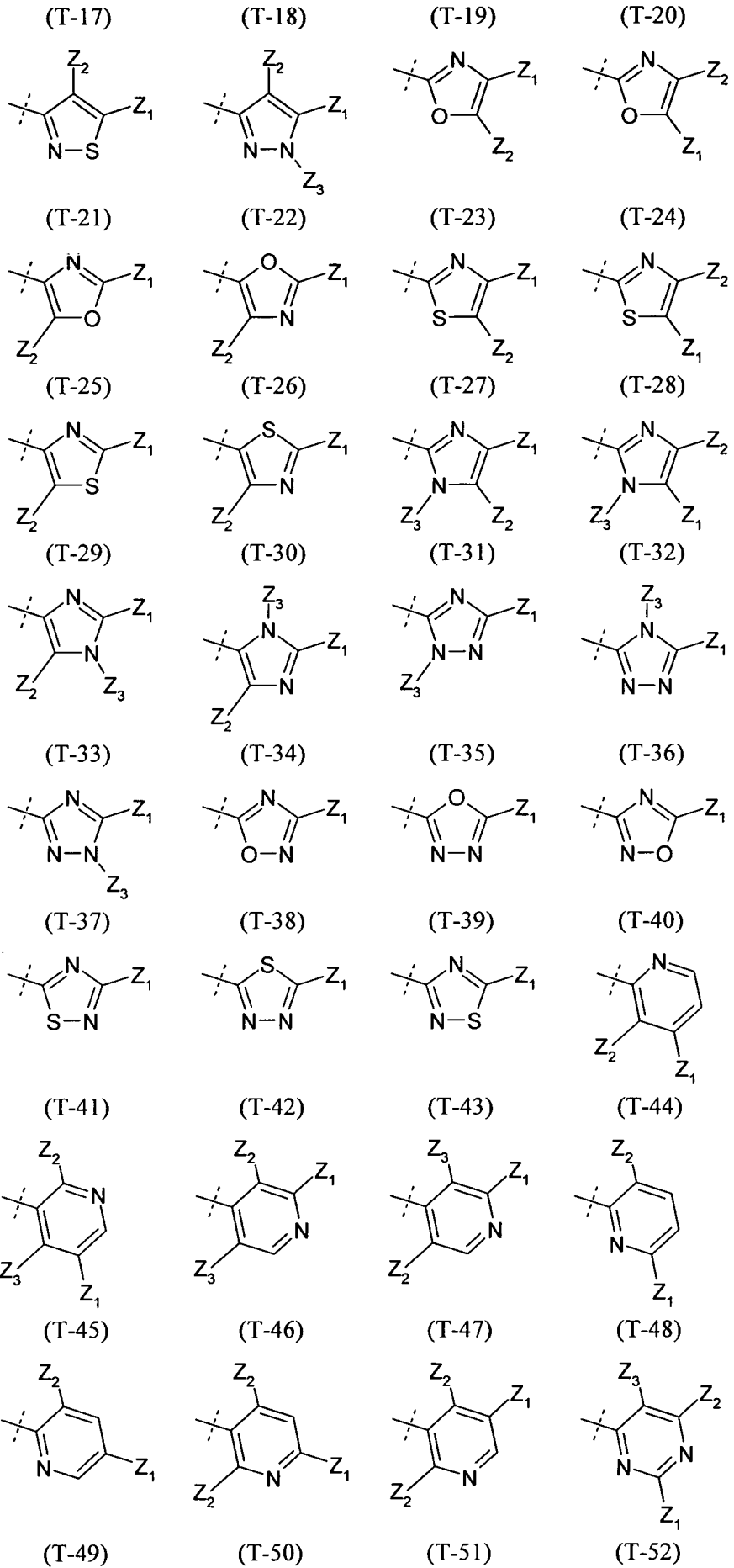


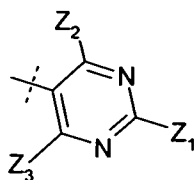
(T-15)



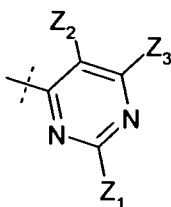
(T-16)



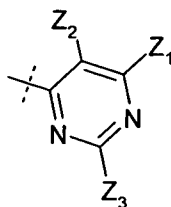




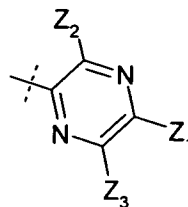
(T-53)



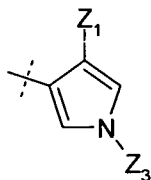
(T-54)



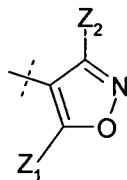
(T-55)



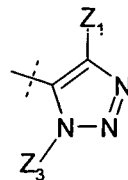
(T-56)



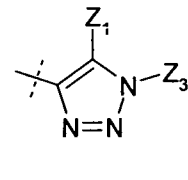
(T-57)



(T-58)



(T-59)



(T-60)

wobei

- Z_1 für ein gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Halogenacycloalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, (C_3 - C_6 -Cycloalkyl)carbonyl, (C_3 - C_6 -Cycloalkyl)-(C_1 - C_3 -alkyl), Aryl-(C_1 - C_3 -alkyl), Heteroaryl-(C_1 - C_3 -alkyl) oder gegebenenfalls mit R^{14} substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht,
- Z_2 für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogenacycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, N,N -Di-(C_1 - C_6 -alkyl)amino, $-C(=W)NR^7R^6$, $-C(=W)OR^8$, $-S(O)_2NR^9R^{10}$, $-S(O)_pR^{11}$, $-S(O)(=NR^{12})R^{13}$ und gegebenenfalls mit R^{14} substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;
- Z_3 für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogenacycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, und gegebenenfalls mit R^{14} substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;
- R^7 ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, (C_1 - C_6 -Alkyl)carbonyl und (C_1 - C_6 -Alkoxy)carbonyl;
- R^8 ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R^6 substituierten Gruppierung C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogenacycloalkyl, (C_1 - C_2 -Alkyl)-(C_3 - C_6 -cycloalkyl) und (C_3 - C_6 -Cycloalkyl)-(C_1 - C_2 -Alkyl);

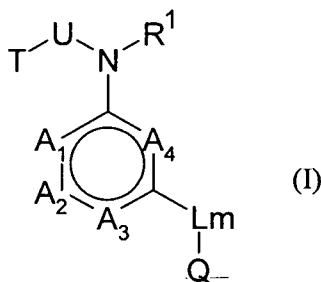
- R⁹ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 5 R¹⁰ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁵ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);
- R¹¹ ausgewählt ist aus den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl) und C₁-C₄-Haloalkyl;
- 10 R¹² ausgewählt ist aus Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- R¹³ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl);
- 15 R¹⁴ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl;
- 20 R¹⁵ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁷ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, -CN, -NO₂ sowie gegebenenfalls mit R¹⁶ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- 25 R¹⁶ ausgewählt ist aus Halogen, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, oder gegebenenfalls mit R¹⁸ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- 30 R¹⁷ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂ oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-

Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, N-C₁-C₆-Alkylamino, N,N-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und N,N-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, wobei,

- 5 R¹⁸ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)amino, N,N-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, N,N-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl; oder
- 10

L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I)



15--

in denen

R¹ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, Cyan-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₂-Alkoxy)-(C₁-C₂-alkyl), Aryl(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl(C₁-C₃-alkyl) steht,

20 die chemischen Gruppierungen

A₁ für CR², einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel oder eine Bindung,,

A₂ für CR³ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

25 A₃ für CR⁴ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel und

A₄ für CR⁵ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A₁ bis A₄ gleichzeitig für Stickstoff stehen;

- 5 R², R³, R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, CN, NO₂, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)amino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, *N*-(C₃-C₆-Cycloalkyl)aminocarbonyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, stehen;
- 10

wenn keine der Gruppierungen A₂ und A₃ für Stickstoff steht, können R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält, oder

15

wenn keine der Gruppierungen A₁ und A₂ für Stickstoff steht, können R² und R³ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome enthält;

G für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkinyll, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

20

U für eine Gruppierung C(=W), SO oder SO₂ steht,

wobei

W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

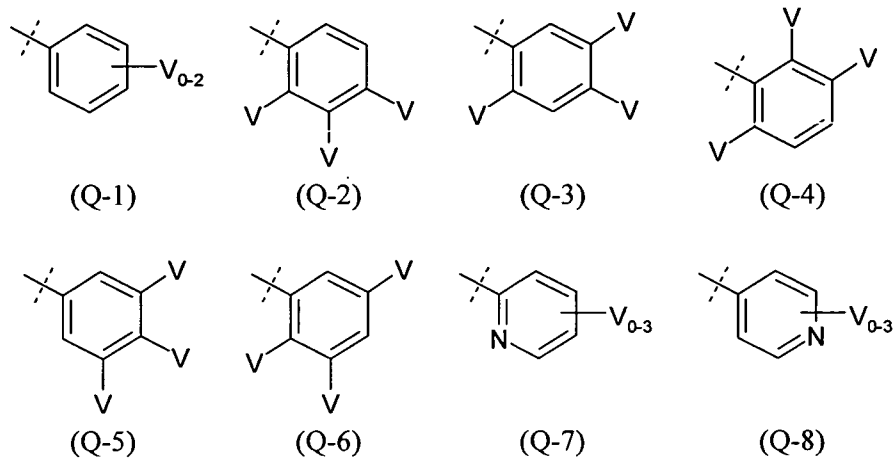
25 L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den Gruppierungen -C(=O)NH-, -C(=O)NR⁶, -C(=O)NHSO₂-, bei der die rechte Seite der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,

R⁶ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl), C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyll, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl steht;

30

m den Wert 1 annimmt;

Q für einen der unten dargestellten Reste (Q-1) – (Q-8) steht,



wobei

5 V für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino steht;

-10—T für (T-1), (T-2), (T-3), (T-4), (T-5), (T-8), (T-9), (T-11), (T-12), (T-13), (T-14), (T-17), (T-18), (T-19), (T-20), (T-21), (T-22), (T-23), (T-24), (T-25), (T-26), (T-27), (T-28), (T-29), (T-30), (T-31), (T-33), (T-34), (T-35), (T-44), (T-45), (T-46), (T-47), (T-48), (T-49), (T-50), (T-51), (T-53), (T-55), (T-57), (T-58), (T-59), (T-60),

wobei

15 Z₁ für ein gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₃-alkyl), Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl) oder gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht,

20 Z₂ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-

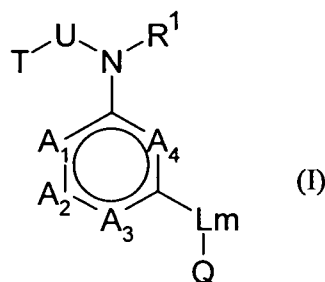
Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, -C(=W)NR⁷R⁶, -C(=W)OR⁸, -S(O)₂NR⁹R¹⁰, -S(O)_pR¹¹, -S(O)(=NR¹²)R¹³ und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

- 5 Z₃ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;
- R⁷ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 10 R⁸ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R⁶ substituierten Gruppierung C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);
- 15 R⁹ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 20 R¹⁰ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁵ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);
- R¹¹ ausgewählt ist aus den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl) und C₁-C₄-Haloalkyl;
- 25 R¹² ausgewählt ist aus Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 30 R¹³ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl);

- 5 R¹⁴ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl;
- 10 R¹⁵ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁷ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, -CN, -NO₂ sowie gegebenenfalls mit R¹⁶ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- R¹⁶ ausgewählt ist aus Halogen, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, oder gegebenenfalls mit R¹⁸ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;
- 15 R¹⁷ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂ oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, wobei,
- 20 R¹⁸ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)amino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl; oder
- 25

L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

30 Ganz besonders bevorzugt sind auch Verbindungen der Formel (I)



in denen

- 5 R^1 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, sec-Butylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl steht;

die chemischen Gruppierungen

- 10 A_1 für CR^2 , einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel oder eine Bindung,
- A_2 für CR^3 oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,
- A_3 für CR^4 oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel und
- 15 A_4 für CR^5 oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A_1 bis A_4 gleichzeitig für Stickstoff stehen;

R^2 und R^5 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Fluor und Chlor stehen und

- 20 R^3 und R^4 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl,
- 25 Trifluormethylsulfinyl und *N*-Cyclopropylaminocarbonyl stehen;

G für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Pentafluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, 2-Methoxyethoxymethyl, 5 Methylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Phenyl, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Chlor-4-trifluormethyl-phenyl steht;

wobei

10 U für C(=W) und,

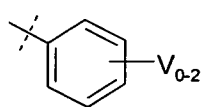
W für Sauerstoff steht;

L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den Gruppierungen $-C(=O)NH-$, $-C(=O)NR^6$, $-C(=O)NHSO_2-$, bei der die rechte Seite der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,

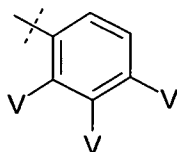
15 R^6 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, sec-Butylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Pyrid-2-yl-methyl, 20 Pyrid-3-yl-methyl und Pyrid-4-yl-methyl steht;

m den Wert 1 annimmt;

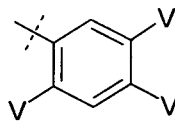
Q für einen der unten dargestellten Reste (Q-1) – (Q-8) steht,



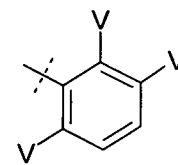
(Q-1)



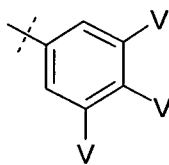
(Q-2)



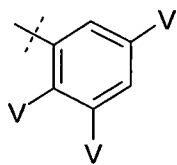
(Q-3)



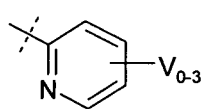
(Q-4)



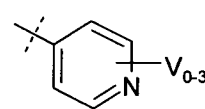
(Q-5)



(Q-6)



(Q-7)



(Q-8)

V für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-
 5 Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Pentafluor-tert-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy,
 10 Pentafluorethoxy, Methylthio, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl steht;

T für (T-8), (T-9), (T-11), (T-17), (T-18), (T-19), (T-21), (T-29), (T-35), (T-44), (T-49), (T-50), (T-53), (T-55), (T-57),

wobei

15 Z₁ für Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Pentafluor-tert-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl,
 20 Nonafluor-n-butyl, —Trifluormethoxy-1,1,2,2-tetrafluorethoxy-difluormethyl, —Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopropyl-hydroxymethyl, Cyclopropylfluormethyl, Cyclopropylcarbonyl, 2,2,2-Trifluorethoxy, 1-Trifluormethylethoxy, 3,3,3,2,2-Pentafluorpropoxy, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Fluorphenyl, 2-Methylphenyl, 3-Methylphenyl, 4-Methylphenyl, 3-Trifluormethylphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 4-Nitrophenyl, 4-(*tert*-Butyl)phenyl, 4-Methoxyphenyl, 4-Phenoxyphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 3,4-Dichlorphenyl, 3,5-Dichlorphenyl, 2,5-Dichlorphenyl, 2,6-Difluorphenyl, 4-Trifluormethoxyphenyl, 4-Cyanophenyl, 2-Trifluormethyl-pyrid-5-yl, 3-Chlor-5-trifluormethyl-pyrid-2-yl, (3,5-Bis(trifluormethyl)-
 25 1H-pyrazol-1-yl)-methyl, (3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl)-methyl, (3,5-Bis(trifluormethyl)-1H-triazol-1-yl)-methyl, (2-Methyl-2-H-tetrazol-5-yl)-methyl, (5-Trifluormethyl-2H-tetrazol-2-yl)-methyl, (3,5-Dichlorphenyl)-methyl, (3,5-Bis(trifluormethyl)phenyl)-methyl, (2,4-Dichlorphenyl)-methyl, (2,6-Dichlorphenyl)-methyl, (4-Chlorphenyl)-methyl, (4-Trifluormethylphenyl)-methyl steht,

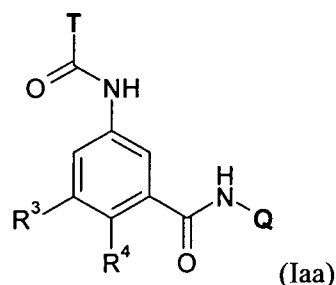
Z₂ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, Ethinyl, 1-Propinyl, 1-Butinyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Pentafluor-tert-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, Methylthio, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl, *N,N*-Dimethylamino, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Trifluormethylphenyl steht;

Z₃ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Pentafluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, 2-Methoxyethoxymethyl, Methylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Phenyl, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Chlor-4-trifluormethyl-phenyl steht;

ferner können

L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (Iaa),



in denen

R³ für einen Rest ausgewählt aus Fluor, Chlor oder Brom steht,

R⁴ für einen Rest ausgewählt aus Fluor, Chlor, Brom, Iod oder S-Methyl steht,

der Rest T für

1-Ethyl-3,4-Bis(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-
 5 (trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3,4-Bis(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, 2-
 (Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-yl, 2-(Trifluormethyl)-1,3-thiazol-4-
 yl, 2-(Trifluormethyl)-1,3-thiazol-4-yl, 2,4-Bis(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl, 2-Methyl-
 6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl, 4-(Difluormethyl)-2-(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl, 4-
 (Pyrid-2-yl)-2-(trifluormethyl)-pyrimidin-5-yl, 4-Brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1*H*-
 10 pyrazol-5-yl, 4-Brom-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, oder 4-Cyclopropyl-2-
 (pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl steht

und

der Rest Q ausgewählt sein kann aus:

Pyridin-4-yl, Pyridin-3-yl, 2-Fluorphenyl, 3-Fluorphenyl, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorpyridin-3-
 15 yl, 2-Chlorpyridin-4yl, 6-Chlorpyridin-3-yl, Pyridin-2-yl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl,
 4-Chlorphenyl, 4-Methoxyphenyl, 2-Chlorpyridin-3-yl, Phenyl, 3-Methoxyphenyl, 6-
 Chlorpyridin-2-yl, 2,4-Difluorphenyl, 4-Fluor-2-methylphenyl, 4-Chlorpyridin-2-yl, 4-
 Fluor-3-methylphenyl, 2-Chlor-4-fluor-5-methylphenyl, 3-Chlor-4-fluor-2-methylphenyl,
 5-Chlorpyridin-2-yl, 4-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl, 3,4-Dichlorphenyl, 3,4,5-
 20 Trichlorphenyl, 4-(Trifluormethyl)phenyl, 3-(Trifluormethyl)phenyl.

Erfindungsgemäß steht "Alkyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe –
 für geradkettige oder verzweigte Kohlenstoffwasserstoffe, vorzugsweise mit 1 bis 6
 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-
 25 Butyl, tert-Butyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,1-
 Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-
 Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,3-Dimethylbutyl, 1,4-Dimethylbutyl, 2,3-
 Dimethylbutyl, 1,1-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl,
 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethylbutyl und 2-Ethylbutyl. Ferner bevorzugt für Alkyle mit 1 bis 4
 30 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem Methyl, Ethyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl,
 Isobutyl, sec-Butyl oder tert-Butyl. Die erfindungsgemäßen Alkyle können mit einem oder
 mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Alkenyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettige oder verzweigte Kohlenstoffwasserstoffe, vorzugsweise mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und mindestens einer Doppelbindung, wie beispielsweise Vinyl, 2-Propenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl. Ferner bevorzugt für Alkenyle mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem 2-Propenyl, 2-Butenyl oder 1-Methyl-2-propenyl. Die erfindungsgemäßen Alkenyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Alkynyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettige oder verzweigte Kohlenstoffwasserstoffe, vorzugsweise mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und mindestens einer Dreifachbindung wie beispielsweise 2-Propinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1,1-dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl und 2,5-Hexadiynyl. Ferner bevorzugt für Alkynyle mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen wie unter anderem Ethinyl, 2-Propinyl oder 2-Butinyl-2-propenyl. Die erfindungsgemäßen Alkynyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Cycloalkyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für mono-, bi- oder tricyclische Kohlenwasserstoffe, vorzugsweise mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl, Bicyclo[2.2.2]octyl oder Adamantyl. Ferner bevorzugt für Cycloalkyle mit 3, 4, 5, 6 oder 7 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem Cyclopropyl oder Cyclobutyl. Die erfindungsgemäßen Cycloalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Alkylcycloalkyl" für mono-, bi- oder tricyclisches Alkylcycloalkyl, vorzugsweise mit 4 bis 10 oder 4 bis 7 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Ethylcyclopropyl, Isopropylcyclobutyl, 3-Methylcyclopentyl und 4-Methyl-cyclohexyl. Ferner bevorzugt für Alkylcycloalkyle mit 4, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen wie unter anderen Ethylcyclopropyl oder 4-Methyl-cyclohexyl. Die erfindungsgemäßen Alkylcycloalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Cycloalkylalkyl" für mono, bi- oder tricyclisches Cycloalkylalkyl, vorzugsweise mit 4 bis 10 oder 4 bis 7 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl und Cyclopentylethyl. Ferner bevorzugt für Cycloalkylalkyle mit 4, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen wie unter anderen Cyclopropylmethyl oder Cyclobutylmethyl. Die erfindungsgemäßen Cycloalkylalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Halogen" für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom.

Die erfindungsgemäßen mit Halogen substituierten chemischen Gruppen, wie beispielsweise Halogenalkyl, Halogencycloalkyl, Halogenalkyloxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsunfinyl oder Halogenalkylsulfonyl sind einfach oder mehrfach bis zur maximal möglichen Substituentenzahl mit Halogen substituiert. Bei mehrfacher Substitution mit Halogen, können die Halogenatome gleich oder verschieden sein und können alle an eines oder an mehrere Kohlenstoffatome gebunden sein. Dabei steht Halogen insbesondere für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom und besonders bevorzugt für Fluor.

Erfindungsgemäß steht "Halogencycloalkyl" für mono-, bi- oder tricyclisches Halogencycloalkyl, vorzugsweise mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen, wie unter anderen 1-Fluor-cyclopropyl, 2-Fluor-cyclopropyl oder 1-Fluor-cyclobutyl. Ferner bevorzugt für Halogencycloalkyl mit 3, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Halogencycloalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Halogenalkyl" "Halogenalkenyl" oder "Halogenalkinyl" für mit Halogen substituierte Alkyle, Alkenyle oder Alkinyle mit vorzugsweise 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, wie beispielsweise Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl) wie $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$, CHClCH_3 , CHFCH_3 , CH_2Cl , CH_2F ; Perhaloalkyl wie CCl_3 oder CF_3 oder CF_2CF_3 ; Polyhaloalkyl wie CHF_2 , CH_2F , CH_2CHFCl , CHCl_2 , $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$, CH_2CF_3 . Entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierten Reste. Haloalkoxy ist z.B. OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , OCF_2CF_3 , OCH_2CF_3 und $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$;

Weitere Beispiele für Halogenalkyle sind Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, Pentafluorethyl und Pentafluor-tert-butyl. Bevorzugt sind Halogenalkyle mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9, vorzugsweise 1 bis 5 gleichen oder
5 verschiedenen Halogenatomen, die ausgewählt sind unter Fluor, Chlor oder Brom. Besonders bevorzugt sind Halogenalkyle mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und mit 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, die ausgewählt sind unter Fluor oder Chlor, wie unter anderen Difluormethyl, Trifluormethyl oder 2,2-Difluorethyl.

Erfindungsgemäß steht "Hydroxyalkyl" für geradkettigen oder verzweigten Alkohol, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol, Isobutanol, sec-Butanol und tert-Butanol. Ferner bevorzugt für Hydroxyalkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Hydroxyalkylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein

Erfindungsgemäß steht "Alkoxy" für geradkettiges oder verzweigtes O-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, Isopropoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy und tert-Butoxy. Ferner bevorzugt für Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkoxygruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Halogenalkoxy" für mit Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes O-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem
20 ~~Difluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy~~ und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy. Ferner bevorzugt für Halogenalkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Halogenalkoxygruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Alkylthio" für geradkettiges oder verzweigtes S-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, Isopropylthio, n-Butylthio, Isobutylthio, sec-Butylthio und tert-Butylthio. Ferner bevorzugt für Alkylthiogruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkylthiogruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Beispiele für Halogenalkylthioalkyle, d.h. mit Halogen substituierte Alkylthiogruppen, sind unter anderem Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trichlormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 1,1,2,2-Tetrafluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio oder 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylthio.

Erfindungsgemäß steht "Alkylsulfinyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkylsulfinyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n-Propylsulfinyl, Isopropylsulfinyl, n-Butylsulfinyl, Isobutylsulfinyl, sec-Butylsulfinyl und tert-Butylsulfinyl. Ferner bevorzugt für Alkylsulfinylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die
5 erfindungsgemäßen Alkylsulfinylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Beispiele für Halogenalkylsulfinylgruppen, d.h. mit Halogen substituierte Alkylsulfinylgruppen, sind unter anderem Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Trichlormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl, 1-Fluorethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl,
10 1,1,2,2-Tetrafluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylsulfinyl.

Erfindungsgemäß steht "Alkylsulfonyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkylsulfonyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n-Propylsulfonyl, Isopropylsulfonyl, n-Butylsulfonyl, Isobutylsulfonyl, sec-Butylsulfonyl und tert-Butylsulfonyl. Ferner bevorzugt für Alkylsulfonylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die
15 erfindungsgemäßen Alkylsulfonylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Beispiele für Halogenalkylsulfonylgruppen, d.h. mit Halogen substituierte Alkylsulfonylgruppen sind unter anderem Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, 1-Fluorethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl,
20 1,1,2,2-Tetrafluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylsulfonyl.

Erfindungsgemäß steht "Alkylcarbonyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl-C(=O), vorzugsweise mit 2 bis 7 Kohlenstoffatomen, wie Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, sec-Butylcarbonyl und tert-Butylcarbonyl. Ferner bevorzugt für Alkylcarbonyle mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkylcarbonyle können
25 mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Cycloalkylcarbonyl" für geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkylcarbonyl, vorzugsweise mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil, wie beispielsweise Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclohexylcarbonyl, Cycloheptylcarbonyl, Cyclooctylcarbonyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl, Bicyclo[2.2.2]octylcarbonyl und Adamantylcarbonyl. Ferner bevorzugt für Cycloalkylcarbonyl mit 3, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil. Die erfindungsgemäßen Cycloalkylcarbonylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Alkoxy-carbonyl" – in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe – für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, wie beispielsweise Methoxy-carbonyl, Ethoxy-carbonyl, n-Propoxy-carbonyl, Isopropoxy-carbonyl, sec-Butoxy-carbonyl und tert-Butoxy-carbonyl. Die erfindungsgemäßen Alkoxy-carbonylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Alkylaminocarboxyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkylaminocarboxyl mit vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, wie beispielsweise Methylaminocarboxyl, Ethylaminocarboxyl, n-Propylaminocarboxyl, Isopropylaminocarboxyl, sec-Butylaminocarboxyl und tert-Butylaminocarboxyl. Die erfindungsgemäßen Alkylaminocarboxylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "*N,N*-Dialkylamino-carboxyl" für geradkettiges oder verzweigtes *N,N*-Dialkylaminocarboxyl mit vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, wie beispielsweise *N,N*-Dimethylamino-carboxyl, *N,N*-Diethylamino-carboxyl, *N,N*-Di(*n*-propylamino)-carboxyl, *N,N*-Di-(isopropylamino)-carboxyl und *N,N*-Di-(sec-butylamino)-carboxyl. Die erfindungsgemäßen *N,N*-Dialkylamino-carboxylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Erfindungsgemäß steht "Aryl" für ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System mit vorzugsweise 6 bis 14, insbesondere 6 bis 10 Ring-Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Anthryl, Phenanthrenyl, vorzugsweise Phenyl. Ferner steht Aryl auch für mehrcyclische Systeme, wie Tetrahydronaphthyl, Indenyl, Indanyl, Fluorenyl, Biphenyl, wobei die Bindungsstelle am aromatischen System ist. Die erfindungsgemäßen Arylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Beispiele substituierter Aryle stellen die Arylalkyle dar, die gleichfalls mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten im Alkyl- und/oder Arylteil substituiert sein können. Beispiele solcher Arylalkyle sind unter anderem Benzyl und 1-Phenylethyl.

Erfindungsgemäß steht "Heterocyclus", "heterocyclischer Ring" oder "heterocyclisches Ringsystem" für ein carbocyclisches Ringsystem mit mindestens einem Ring, in dem mindestens ein Kohlenstoffatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, vorzugsweise durch ein Heteroatom aus der Gruppe N, O, S, P, B, Si, Se und der gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch ist und dabei unsubstituiert oder mit einem Substituenten Z substituiert sein kann, wobei die Bindungsstelle an einem Ringatom lokalisiert ist. Wenn nicht anders definiert, enthält der heterocyclische Ring vorzugsweise 3 bis 9 Ringatome, insbesondere 3 bis 6 Ringatome, und ein oder mehrere,

vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1, 2 oder 3 Heteroatome im heterocyclischen Ring, vorzugsweise aus der Gruppe N, O, und S, wobei jedoch nicht zwei Sauerstoffatome direkt benachbart sein sollen. Die heterocyclischen Ringe enthalten gewöhnlicherweise nicht mehr als 4 Stickstoffatome, und/oder nicht mehr als 2 Sauerstoffatome und/oder nicht mehr als 2 Schwefelatome. Ist der Heterocyclrest oder der heterocyclische Ring gegebenenfalls substituiert, kann er mit anderen carbocyclischen oder heterocyclischen Ringen annelliert sein. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Heterocycl werden erfindungsgemäß auch mehrcyclische Systeme umfaßt, wie beispielsweise 8-Aza-bicyclo[3.2.1]octanyl oder 1-Aza-bicyclo[2.2.1]heptyl. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Heterocycl werden erfindungsgemäß auch spirocyclische Systeme umfaßt, wie beispielsweise 1-Oxa-5-aza-spiro[2.3]hexyl.

Erfindungsgemäße Heterocyclgruppen sind beispielsweise Piperidinyl, Piperazinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl, Dihydropyranyl, Tetrahydropyranyl, Dioxanyl, Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, Imidazoliny, Imidazolidinyl, Thiazolidinyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Dioxolyl, Pyrazolidinyl, Tetrahydrofuranly, Dihydrofuranly, Oxetanyl, Oxiranyl, Azetidiny, Aziridinyl, Oxazetidiny, Oxaziridinyl, Oxazepanyl, Oxazinanyl, Azepanyl, Oxopyrrolidinyl, Dioxopyrrolidinyl, Oxomorpholinyl, Oxopiperazinyl und Oxepanyl.

Eine besondere Bedeutung kommt Heteroarylen, also heteroaromatischen Systemen zu. Erfindungsgemäß steht der Ausdruck Heteroaryl für heteroaromatische Verbindungen, das heißt vollständig ungesättigte aromatische heterocyclische Verbindungen, die unter die vorstehende Definiton von Heterocyclen fallen. Vorzugsweise für 5- bis 7-gliedrige Ringe mit 1 bis 3, vorzugsweise 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der oben genannten Gruppe. Erfindungsgemäße Heteroaryle sind beispielsweise Furyl, Thienyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, 1,2,3- und 1,2,4-Triazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- und 1,2,5-Oxadiazolyl, Azepiny, Pyrrolyl, Pyridyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, 1,3,5-, 1,2,4- und 1,2,3-Triazinyl, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- und 1,2,6-Oxazinyl, Oxepiny, Thiepinyl, 1,2,4-Triazolonyl und 1,2,4-Diazepiny. Die erfindungsgemäßen Heteroarylgruppen können ferner mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

Substituierte Gruppen, wie ein substituiertes Alkyl-, Alkenyl-, Alkiny-, Cycloalkyl-, Aryl-, Phenyl-, Benzyl-, Heterocycl- und Heteroarylrest, bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Alkylthio, Hydroxy, Amino, Nitro, Carboxy oder eine der Carboxygruppe äquivalente Gruppe, Cyano, Isocyano, Azido, Alkoxy-carbonyl, Alkyl-carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und *N,N*-Dialkylamino-carbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und *N,N*-Dialkylamino, Trialkylsilyl und gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl,

gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, wobei jeder der letztgenannten cyclischen Gruppen auch über Heteroatome oder divalente funktionelle Gruppen wie bei den genannten Alkylresten gebunden sein kann, und Alkylsulfinyl, wobei beide Enantiomere der Alkylsulfonylgruppe umfasst sind, Alkylsulfonyl, Alkylphosphinyl, Alkylphosphonyl und, im Falle cyclischer Reste (= "cyclischer Grundkörper"), auch Alkyl, Haloalkyl, Alkylthio-alkyl, Alkoxy-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Mono- und *N,N*-Dialkyl-aminoalkyl und Hydroxyalkyl bedeutet.

Im Begriff "substituierte Gruppen" wie substituiertes Alkyl etc. sind als Substituenten zusätzlich zu den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische und aromatische Reste, wie gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkenylthio, Alkinylthio, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Mono- und *N,N*-Dialkenylamino-carbonyl, Mono- und Dialkenylaminocarbonyl, Mono- und *N,N*-Dialkenylamino, Mono- und *N,N*-Dialkinylamino, Trialkenylsilyl, Trialkinylsilyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkinyl, Phenyl, Phenoxy etc. eingeschlossen. Im Falle von substituierten cyclischen Resten mit aliphatischen Anteilen im Ring werden auch cyclische Systeme mit solchen Substituenten umfaßt, die mit einer Doppelbindung am Ring gebunden sind, z. B. mit einer Alkylidengruppe wie Methyliden oder Ethyliden oder einer Oxogruppe, Iminogruppe sowie einer substituierten Iminogruppe.

Wenn zwei oder mehrere Reste einen oder mehrere Ringe bilden, so können diese carbocyclisch, heterocyclisch, gesättigt, teilgesättigt, ungesättigt, beispielsweise auch aromatisch und weiter substituiert sein.

Die beispielhaft genannten Substituenten ("erste Substituentenebene") können, sofern sie kohlenwasserstoffhaltige Anteile enthalten, dort gegebenenfalls weiter substituiert sein ("zweite Substituentenebene"), beispielsweise durch einen der Substituenten, wie er für die erste Substituentenebene definiert ist. Entsprechende weitere Substituentenebenen sind möglich. Vorzugsweise werden vom Begriff "substituierter Rest" nur ein oder zwei Substituentenebenen umfasst.

Bevorzugte Substituenten für die Substituentenebenen sind beispielsweise

Amino, Hydroxy, Halogen, Nitro, Cyano, Isocyano, Mercapto, Isothiocyanato, Carboxy, Carbonamid, SF₅, Aminosulfonyl, Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Cycloalkenyl, Alkinyl, *N*-Monoalkyl-amino, *N,N*-Dialkylamino, *N*-Alkanoylamino, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Aryloxycarbonyl, Alkanoyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Arylcarbonyl, Alkylthio, Cycloalkylthio, Alkenylthio, Cycloalkenylthio, Alkinylthio, Alkylsulfonyl und Alkylsulfinyl,

wobei beide Enantiomere der Alkylsulfinylgruppe umfasst sind, Alkylsulfonyl, *N*-Mono-alkyl-aminosulfonyl, *N,N*-Dialkyl-aminosulfonyl, Alkylphosphinyl, Alkylphosphonyl, wobei für Alkylphosphinyl bzw. Alkylphosphonyl beide Enantiomere umfasst sind, *N*-Alkyl-aminocarbonyl, *N,N*-Dialkyl-amino-carbonyl, *N*-Alkanoyl-amino-carbonyl, *N*-Alkanoyl-*N*-alkyl-aminocarbonyl, Aryl, Aryloxy, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio, Arylthio, Arylamino, Benzylamino, Heterocyclyl und Trialkylsilyl.

Substituenten, die aus mehreren Substituentenebenen zusammengesetzt sind, sind bevorzugt Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Alkylthioalkoxy, Alkoxyalkoxy, Phenethyl, Benzyloxy, Halogenalkyl, Halogencycloalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl, Halogenalkylsulfonyl, Halogenalkanoyl, Halogenalkylcarbonyl, Halogenalkoxycarbonyl, Halogenalkoxyalkoxy, Halogenalkoxyalkylthio, Halogenalkoxyalkanoyl, Halogenalkoxyalkyl.

Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 6 C-Atomen, vorzugsweise 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen bevorzugt. Bevorzugt sind in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z.B. Fluor und Chlor, (C₁-C₄)Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, (C₁-C₄)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy, Fluor und Chlor.

Substituiertes Amino wie mono- oder disubstituiertes Amino bedeutet einen Rest aus der Gruppe der substituierten Aminoreste, welche beispielsweise durch einen bzw. zwei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Alkyl, Hydroxy, Amino, Alkoxy, Acyl und Aryl *N*-substituiert sind; vorzugsweise *N*-Mono- und *N,N*-Dialkylamino, (z.B. Methylamino, Ethylamino, *N,N*-Dimethylamino, *N,N*-Diethylamino, *N,N*-Di-*n*-propylamino, *N,N*-Diisopropylamino oder *N,N*-Dibutylamino), *N*-Mono- oder *N,N*-Dialkoxyalkylaminogruppen (z.B. *N*-Methoxymethylamino, *N*-Methoxyethylamino, *N,N*-Di-(methoxymethyl)-amino oder *N,N*-Di-(methoxyethyl)-amino), *N*-Mono- und *N,N*-Diarylamino, wie gegebenenfalls substituierte Aniline, Acylamino, *N,N*-diacylamino, *N*-Alkyl-*N*-arylamino, *N*-Alkyl-*N*-acylamino sowie gesättigte *N*-Heterocyclen; dabei sind Alkylreste mit 1 bis 4 C-Atomen bevorzugt; Aryl ist dabei vorzugsweise Phenyl oder substituiertes Phenyl; für Acyl gilt dabei die weiter unten genannte Definition, vorzugsweise (C₁-C₄)Alkanoyl. Entsprechendes gilt für substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

Erfindungsgemäß umfasst der Begriff "cyclische Aminogruppen" heteroaromatische oder aliphatische Ringsysteme mit einem oder mehreren Stickstoffatomen. Die Heterocyclen sind gesättigt oder ungesättigt, bestehen aus einem oder mehreren, gegebenenfalls kondensierten Ringsystemen und beinhalten gegebenenfalls weitere Heteroatome, wie beispielsweise ein oder zwei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome. Ferner umfasst der Begriff auch solche Gruppen, die einen Spiroring oder verbrücktes Ringsystem aufweisen. Die Anzahl der Atome, die

die cyclische Aminogruppe bilden, ist beliebig und kann z.B. im Falle eines Einringssystems aus 3 bis 8 Ringatomen und im Falle eines Zweiringssystems aus 7 bis 11 Atomen.

Beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit einem Stickstoffatom als Heteroatom seien 1-Azetidinyl, Pyrrolidino, 2-Pyrrolidin-1-yl, 1-Pyrrolyl, Piperidino, 1,4-Dihydropyrazin-1-yl, 1,2,5,6-Tetrahydropyrazin-1-yl, 1,4-Dihydropyridin-1-yl, 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-1-yl, Homopiperidinyl genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit zwei oder mehreren Stickstoffatomen als Heteroatome seien 1-Imidazolidinyl, 1-Imidazolyl, 1-Pyrazolyl, 1-Triazolyl, 1-Tetrazolyl, 1-Piperazinyl, 1-Homopiperazinyl, 1,2-Dihydro-piperazin-1-yl, 1,2-Dihydro-pyrimidin-1-yl, Perhydropyrimidin-1-yl, 1,4-Diazacycloheptan-1-yl, genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit einem oder zwei Sauerstoffatomen und einem bis drei Stickstoffatomen als Heteroatome, wie beispielsweise Oxazolidin-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-2-yl, Isoxazol-2-yl, 1,2,3-Oxadiazin-2-yl, Morpholino, beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit einem bis drei Stickstoffatomen und einem bis zwei Schwefelatomen als Heteroatome seien Thiazolidin-3-yl, Isothiazolin-2-yl, Thiomorpholino, oder Dioxothiomorpholino genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten kondensierten cyclischen Gruppen seien Indol-1-yl, 1,2-Dihydrobenzimidazol-1-yl, Perhydropyrrolo[1,2-a]pyrazin-2-yl genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit spirocyclischen Gruppen sei das 2-Azaspiro[4,5]decan-2-yl genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit verbrückten heterocyclischen Gruppen sei das 2-Azabicyclo[2,2,1]heptan-7-yl genannt.

Substituiertes Amino schließt auch quartäre Ammoniumverbindungen (Salze) mit vier organischen Substituenten am Stickstoffatom ein.

Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Halogenalkyl, (C₁-C₄)Halogenalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Halogenalkylthio, Cyano, Isocyano und Nitro substituiert ist, z.B. o-, m- und p-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Fluorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluormethyl- und -Trichlormethylphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, o-, m- und p-Methoxyphenyl.

Gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl ist vorzugsweise Cycloalkyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)Alkoxy-

(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Halogenalkyl und (C₁-C₄)Halogenalkoxy substituiert ist, insbesondere durch einen oder zwei (C₁-C₄)Alkylreste substituiert ist,

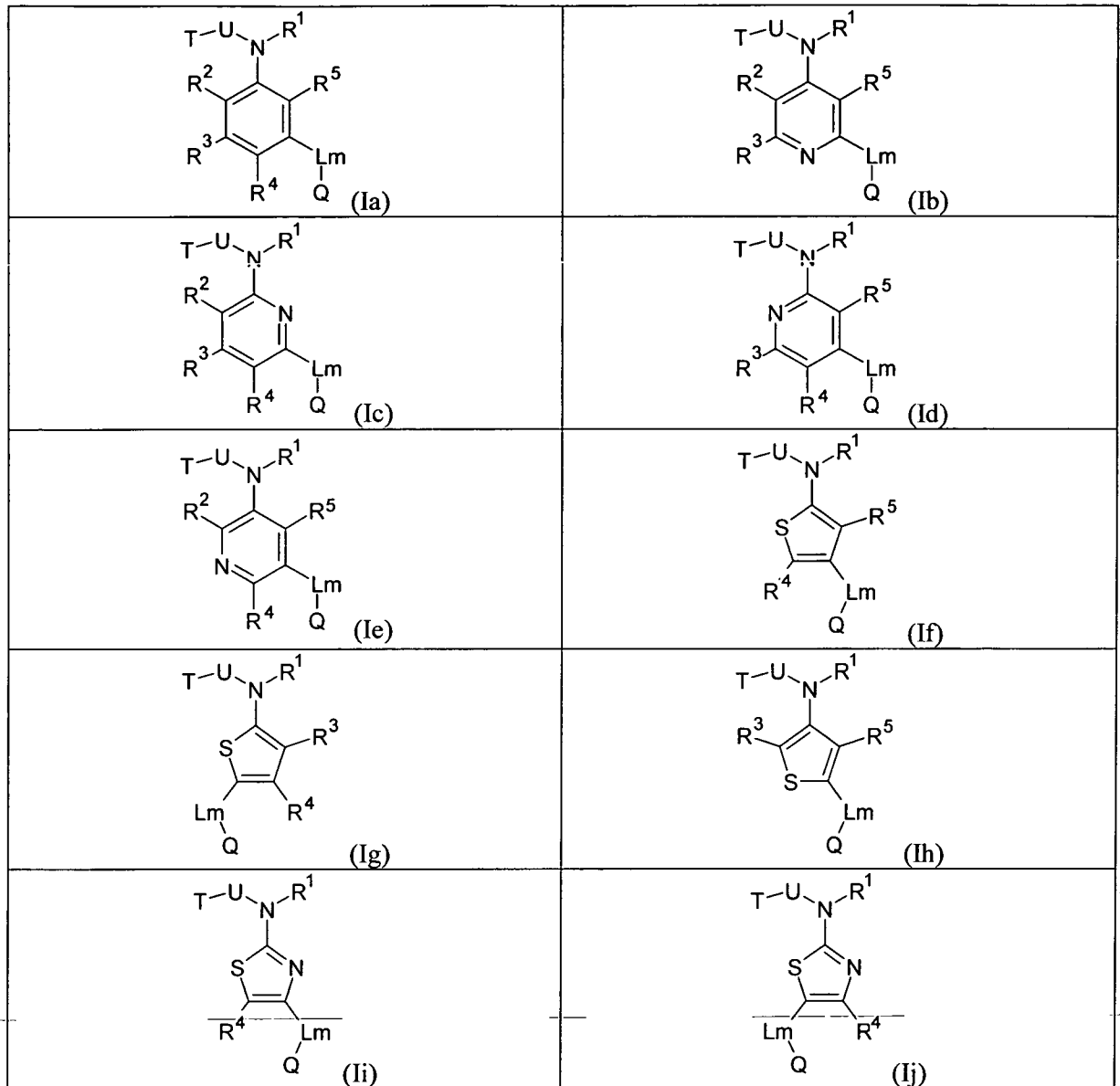
Gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl ist vorzugsweise Heterocyclyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, 5 (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Halogenalkyl, (C₁-C₄)Halogenalkoxy, Nitro und Oxo substituiert ist, insbesondere ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Halogenalkyl und Oxo, ganz besonders durch einen oder zwei (C₁-C₄)Alkylreste substituiert ist.

10 Beispiele für Alkyl substituierte Heteroaryle sind Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrazolymethyl, Imidazolymethyl, 1,2,3- und 1,2,4-Triazolymethyl, Isoxazolymethyl, Thiazolymethyl, Isothiazolymethyl, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- und 1,2,5-Oxadiazolymethyl, Azepinylmethyl, Pyrrolylmethyl, Pyridylmethyl, Pyridazinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyrazinylmethyl, 1,3,5-, 1,2,4- und 1,2,3-Triazinylmethyl, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- und 1,2,6-Oxazinylmethyl, Oxepinylmethyl, 15 Thiopinylmethyl und 1,2,4-Diazepinylmethyl.

Erfindungsgemäß geeignete Salze der erfindungsgemäßen Verbindungen, beispielsweise Salze mit Basen oder Säureadditionssalze, sind alle üblichen nicht toxischen Salze, vorzugsweise landwirtschaftlich und/oder physiologisch annehmbare Salze. Beispielsweise Salze mit Basen oder Säureadditionssalze. Bevorzugt werden Salze mit anorganischen Basen, wie beispielsweise Alkali- 20 metallsalze (z.B. Natrium-, Kalium- oder Cäsiumsalze), Erdalkalimetallsalze (z.B. Calcium- oder Magnesiumsalze), Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Basen, insbesondere mit organischen Aminen, wie beispielsweise Triethylammonium-, Dicyclohexylammonium-, *N,N'*-Dibenzylethylendiammonium-, Pyridinium-, Picolinium- oder Ethanolammoniumsalze, Salze mit anorganischen Säuren (z.B. Hydrochloride, Hydrobromide, Dihydrosulfate, Trihydrosulfate, oder 25 Phosphate), Salze mit organischen Carbonsäuren oder organischen Sulfosäuren (z.B. Formiate, Acetate, Trifluoracetate, Maleate, Tartrate, Methansulfonate, Benzolsulfonate oder 4-Toluolsulfonate). Bekannterweise können tert- Amine, wie beispielsweise manche der erfindungsgemäßen Verbindungen, *N*-Oxide bilden, welche ebenfalls erfindungsgemäße Salze darstellen.

30 Ferner bevorzugte Ausführungsformen der Erfindung stellen die Verbindungen der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) dar.

In den nachfolgenden allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) haben die Gruppierungen und Substituenten U, L, m, Q, T, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Abhängigkeit von der Art der Substituenten als geometrische und/oder als optisch aktive Isomere oder entsprechende Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Diese Stereoisomere sind beispielsweise

5 Enantiomere, Diastereomere, Atropisomere oder geometrische Isomere. Die Erfindung umfasst somit reine Stereoisomere als auch beliebige Gemische dieser Isomere.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in verschiedenen polymorphen Formen oder als Mischung verschiedener polymorpher Formen vorliegen. Sowohl die reinen Polymorphe als auch die Polymorphgemische sind Gegenstand der Erfindung und können

10 erfindungsgemäß verwendet werden.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Verbindungen der Formel (I) sich bei guter Pflanzenverträglichkeit, günstiger Warmblütertoxizität und guter Umweltverträglichkeit vor allem zur

Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Arthropoden, Insekten, Spinnentieren, Helminthen, Nematoden und Mollusken, die in der Landwirtschaft, in den Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor oder im Bereich der Tiergesundheit vorkommen, eignen. Gleichfalls können die erfindungsgemäßen Verbindungen im Bereich der Tiergesundheit
5 verwendet werden, beispielsweise zur Bekämpfung von Endo- und/oder Ectoparasiten.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können als Mittel zur Bekämpfung tierischer Schädlinge, vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in allgemein bekannte Formulierungen überführt
10 werden. Solche Formulierungen enthalten im Allgemeinen von 0,01 bis 98 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise von 0,5 bis 90 Gew.-%.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen oder Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung
15 der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,00000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise von 0,00001 bis 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

20 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder
25 Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Saatgut sowie Wurzeln, Knollen und
30 Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Saatgut.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen, Injizieren und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Saatgut, weiterhin durch
5 ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten
10 Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Die Begriffe "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurden oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in
15 Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

Im Bereich Tiergesundheit, d.h. auf dem veterinärmedizinischen Gebiet, wirken die Wirkstoffe
20 gemäß der vorliegenden Erfindung gegen tierische Parasiten, insbesondere Ektoparasiten oder ~~Endoparasiten.~~ Der Begriff Endoparasiten schließt insbesondere Helminthen wie Cestoden, Nematoden oder Trematoden, und Protozoen wie Coccidien ein. Ektoparasiten sind typischerweise und vorzugsweise Arthropoden, insbesondere Insekten wie Fliegen (stechend und leckend), parasitische Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge, Flöhe und dergleichen; oder Akariden
25 wie Zecken, zum Beispiel Schildzecken oder Lederzecken, oder Milben wie Räude milben, Laufmilben, Federmilben und dergleichen.

Außerdem wurde gefunden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören. Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie
30 vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

Weiter können die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombinationen mit anderen Wirkstoffen als Antifouling-Mittel eingesetzt werden.

Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen im Haushalts-, Hygiene- und Vorratsschutz, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit
5 anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam.

Unter Pflanzen werden alle Pflanzenarten, Pflanzensorten und Pflanzenpopulationen, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen verstanden. Erfindungsgemäß zu behandelnde Kulturpflanzen sind Pflanzen, die natürlich vorkommen, oder solche, die durch
10 konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder durch Kombinationen der vorgenannten Methoden erhalten wurden. Der Begriff Kulturpflanze umfasst selbstverständlich auch transgene Pflanzen.

Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften, sogenannten Traits, die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken oder
15 einer Kombination hieraus gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Unter Pflanzenteilen werden alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden, insbesondere Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte, Samen, Wurzeln, Knollen und Rhizome. Der Begriff Pflanzenteile
20 umfasst weiterhin Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, wie z.B. Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen bzw. Saatgut.

In einer erfindungsgemäßen Ausführungsform werden natürlich vorkommende oder durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden (z.B. Kreuzung oder Protoplastenfusion) erhaltene Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Pflanzenteile behandelt.

25 In einer weiteren erfindungsgemäßen Ausführungsform werden transgene Pflanzen, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden und deren Teile behandelt.

Das erfindungsgemäße Behandlungsverfahren wird vorzugsweise auf genetisch modifizierten Organismen, wie beispielsweise Pflanzen oder Pflanzenteile, verwendet.

30 Genetisch modifizierte Pflanzen, sogenannte transgene Pflanzen, sind Pflanzen, bei denen ein heterologes Gen stabil in das Genom integriert worden ist.

Der Begriff "heterologes Gen" bedeutet im wesentlichen ein Gen, das außerhalb der Pflanze bereitgestellt oder assembliert wird und das bei Einführung in das Zellkerngenom, das Chloroplastengenom oder das Hypochondriengenom der transformierten Pflanze dadurch neue oder verbesserte agronomische oder sonstige Eigenschaften verleiht, daß es ein interessierendes Protein oder Polypeptid exprimiert oder daß es ein anderes Gen, das in der Pflanze vorliegt bzw. andere Gene, die in der Pflanze vorliegen, herunterreguliert oder abschaltet (zum Beispiel mittels Antisense-Technologie, Cosuppressionstechnologie oder RNAi-Technologie [RNA Interference]). Ein heterologes Gen, das im Genom vorliegt, wird ebenfalls als Transgen bezeichnet. Ein Transgen, das durch sein spezifisches Vorliegen im Pflanzengenom definiert ist, wird als Transformations- bzw. transgenes Event bezeichnet.

In Abhängigkeit von den Pflanzenarten oder Pflanzensorten, ihrem Standort und ihren Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) kann die erfindungsgemäße Behandlung auch zu überadditiven ("synergistischen") Effekten führen. So sind zum Beispiel die folgenden Effekte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen: verringerte Aufwandmengen und/oder erweitertes Wirkungsspektrum und/oder erhöhte Wirksamkeit der Wirkstoffe und Zusammensetzungen, die erfindungsgemäß eingesetzt werden können, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegenüber Trockenheit oder Wasser- oder Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, Ernteerleichterung, Reifebeschleunigung, höhere Erträge, größere Früchte, größere Pflanzenhöhe, intensiver grüne Farbe des Blatts, frühere Blüte, höhere Qualität und/oder höherer Nährwert der Ernteprodukte, höhere Zuckerkonzentration in den Früchten, bessere Lagerfähigkeit und/oder-Verarbeitbarkeit der-Ernteprodukte-

In gewissen Aufwandmengen können die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen auch eine stärkende Wirkung auf Pflanzen ausüben. Sie eignen sich daher für die Mobilisierung des pflanzlichen Abwehrsystems gegen Angriff durch unerwünschte phytopathogene Pilze und/oder Mikroorganismen und/oder Viren. Dies kann gegebenenfalls einer der Gründe für die erhöhte Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Kombinationen sein, zum Beispiel gegen Pilze. Pflanzenstärkende (resistenzinduzierende) Substanzen sollen im vorliegenden Zusammenhang auch solche Substanzen oder Substanzkombinationen bedeuten, die fähig sind, das pflanzliche Abwehrsystem so zu stimulieren, daß die behandelten Pflanzen, wenn sie im Anschluß daran mit unerwünschten phytopathogenen Pilzen und/oder Mikroorganismen und/oder Viren inokkuliert werde, einen beträchtlichen Resistenzgrad gegen diese unerwünschten phytopathogenen Pilze und/oder Mikroorganismen und/oder Viren aufweisen. Im vorliegenden Fall versteht man unter unerwünschten phytopathogenen Pilzen und/oder Mikroorganismen und/oder Viren phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren. Die erfindungsgemäßen Substanzen lassen sich daher zum Schutz von Pflanzen gegen Angriff durch die erwähnten Pathogene innerhalb eines gewissen

Zeitraums nach der Behandlung einsetzen. Der Zeitraum, über den eine Schutzwirkung erzielt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tagen, vorzugsweise 1 bis 7 Tagen, nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Pflanzen, die weiterhin vorzugsweise erfindungsgemäß behandelt werden, sind gegen einen oder
5 mehrere biotische Streßfaktoren resistent, d. h. diese Pflanzen weisen eine verbesserte Abwehr gegen tierische und mikrobielle Schädlinge wie Nematoden, Insekten, Milben, phytopathogene Pilze, Bakterien, Viren und/oder Viroide auf.

Neben den vorgenannten Pflanzen und Pflanzensorten, können auch solche erfindungsgemäß behandelt werden, die gegen einen oder mehrere abiotische Streßfaktoren widerstandsfähig sind.

10 Zu den abiotischen Streßbedingungen können zum Beispiel Dürre, Kälte- und Hitzebedingungen, osmotischer Streß, Staunässe, erhöhter Bodensalzgehalt, erhöhtes Ausgesetztsein an Mineralien, Ozonbedingungen, Starklichtbedingungen, beschränkte Verfügbarkeit von Stickstoffnährstoffen, beschränkte Verfügbarkeit von Phosphornährstoffen oder Vermeidung von Schatten zählen.

Pflanzen und Pflanzensorten, die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind solche
15 Pflanzen, die durch erhöhte Ertragseigenschaften gekennzeichnet sind. Ein erhöhter Ertrag kann bei diesen Pflanzen z. B. auf verbesserter Pflanzenphysiologie, verbessertem Pflanzenwuchs und verbesserter Pflanzenentwicklung, wie Wasserverwertungseffizienz, Wasserhalteeffizienz, verbesserter Stickstoffverwertung, erhöhter Kohlenstoffassimilation, verbesserter Photosynthese, verstärkter Keimkraft und beschleunigter Abreife beruhen. Der Ertrag kann weiterhin durch eine
20 verbesserte Pflanzenarchitektur (unter Streß- und nicht-Streß-Bedingungen) beeinflusst werden, darunter frühe Blüte, Kontrolle der Blüte für die Produktion von Hybridsaatgut, Keimpflanzenwüchsigkeit, Pflanzengröße, Internodienzahl und -abstand, Wurzelwachstum, Samengröße, Fruchtgröße, Schotengröße, Schoten- oder Ährenzahl, Anzahl der Samen pro Schote oder Ähre, Samenmasse, verstärkte Samenfüllung, verringerter Samenausfall, verringertes
25 Schotenplatzen sowie Standfestigkeit. Zu weiteren Ertragsmerkmalen zählen Samenzusammensetzung wie Kohlenhydratgehalt, Proteingehalt, Ölgehalt und Ölzusammensetzung, Nährwert, Verringerung der nährwidrigen Verbindungen, verbesserte Verarbeitbarkeit und verbesserte Lagerfähigkeit.

Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Hybridpflanzen, die bereits die
30 Eigenschaften der Heterosis bzw. des Hybrideffekts exprimieren, was im allgemeinen zu höherem Ertrag, höherer Wüchsigkeit, besserer Gesundheit und besserer Resistenz gegen biotische und abiotische Streßfaktoren führt. Solche Pflanzen werden typischerweise dadurch erzeugt, daß man eine ingezüchtete pollensterile Elternlinie (den weiblichen Kreuzungspartner) mit einer anderen ingezüchteten pollenfertilen Elternlinie (dem männlichen Kreuzungspartner) kreuzt. Das

Hybridsaatgut wird typischerweise von den pollensterilen Pflanzen geerntet und an Vermehrer verkauft. Pollensterile Pflanzen können manchmal (z. B. beim Mais) durch Entfahnen (d. h. mechanischem Entfernen der männlichen Geschlechtsorgane bzw. der männlichen Blüten), produziert werden; es ist jedoch üblicher, daß die Pollensterilität auf genetischen Determinanten im Pflanzengenom beruht. In diesem Fall, insbesondere dann, wenn es sich bei dem gewünschten Produkt, da man von den Hybridpflanzen ernten will, um die Samen handelt, ist es üblicherweise günstig, sicherzustellen, daß die Pollenfertilität in Hybridpflanzen, die die für die Pollensterilität verantwortlichen genetischen Determinanten enthalten, völlig restoriert wird. Dies kann erreicht werden, indem sichergestellt wird, daß die männlichen Kreuzungspartner entsprechende Fertilitätsrestorerogene besitzen, die in der Lage sind, die Pollenfertilität in Hybridpflanzen, die die genetischen Determinanten, die für die Pollensterilität verantwortlich sind, enthalten, zu restorieren. Genetische Determinanten für Pollensterilität können im Cytoplasma lokalisiert sein. Beispiele für cytoplasmatische Pollensterilität (CMS) wurden zum Beispiel für Brassica-Arten beschrieben. Genetische Determinanten für Pollensterilität können jedoch auch im Zellkerngenom lokalisiert sein. Pollensterile Pflanzen können auch mit Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie Gentechnik, erhalten werden. Ein besonders günstiges Mittel zur Erzeugung von pollensterilen Pflanzen ist in WO 89/10396 beschrieben, wobei zum Beispiel eine Ribonuklease wie eine Barnase selektiv in den Tapetumzellen in den Staubblättern exprimiert wird. Die Fertilität kann dann durch Expression eines Ribonukleasehemmers wie Barstar in den Tapetumzellen restoriert werden.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die mit Methoden der Pflanzenbiotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten werden), die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind herbizidtolerante Pflanzen, ~~d. h. Pflanzen, die gegenüber einem oder mehreren vorgegebenen Herbiziden tolerant gemacht~~ worden sind. Solche Pflanzen können entweder durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Herbizidtoleranz verleiht, erhalten werden.

Herbizidtolerante Pflanzen sind zum Beispiel glyphosatetolerante Pflanzen, d. h. Pflanzen, die gegenüber dem Herbizid Glyphosate oder dessen Salzen tolerant gemacht worden sind. So können zum Beispiel glyphosatetolerante Pflanzen durch Transformation der Pflanze mit einem Gen, das für das Enzym 5-Enolpyruvylshikimat-3-phosphatsynthase (EPSPS) kodiert, erhalten werden.

Beispiele für solche EPSPS-Gene sind das AroA-Gen (Mutante CT7) des Bakterium *Salmonella typhimurium*, das CP4-Gen des Bakteriums *Agrobacterium sp.*, die Gene, die für eine EPSPS aus der Petunie, für eine EPSPS aus der Tomate oder für eine EPSPS aus Eleusine kodieren. Es kann sich auch um eine mutierte EPSPS handeln. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man ein Gen exprimiert, das für ein Glyphosate-Oxidoreduktase-Enzym kodiert. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man ein Gen exprimiert, das für ein Glyphosate-acetyltransferase-Enzym kodiert. Glyphosatetolerante Pflanzen

können auch dadurch erhalten werden, daß man Pflanzen, die natürlich vorkommende Mutationen der oben erwähnten Gene selektiert.

Sonstige herbizidresistente Pflanzen sind zum Beispiel Pflanzen, die gegenüber Herbiziden, die das Enzym Glutaminsynthase hemmen, wie Bialaphos, Phosphinotricin oder Glufosinate, tolerant gemacht worden sind. Solche Pflanzen können dadurch erhalten werden, daß man ein Enzym
5 exprimiert, das das Herbizid oder eine Mutante des Enzyms Glutaminsynthase, das gegenüber Hemmung resistent ist, entgiftet. Solch ein wirksames entgiftendes Enzym ist zum Beispiel ein Enzym, das für ein Phosphinotricin-acetyltransferase kodiert (wie zum Beispiel das bar- oder pat-Protein aus Streptomyces-Arten). Pflanzen, die eine exogene Phosphinotricin-acetyltransferase
10 exprimieren, sind beschrieben.

Weitere herbizidtolerante Pflanzen sind auch Pflanzen, die gegenüber den Herbiziden, die das Enzym Hydroxyphenylpyruvatdioxygenase (HPPD) hemmen, tolerant gemacht worden sind. Bei den Hydroxyphenylpyruvatdioxygenasen handelt es sich um Enzyme, die die Reaktion, in der para-Hydroxyphenylpyruvat (HPP) zu Homogentisat umgesetzt wird, katalysieren. Pflanzen, die
15 gegenüber HPPD-Hemmern tolerant sind, können mit einem Gen, das für ein natürlich vorkommendes resistentes HPPD-Enzym kodiert, oder einem Gen, das für ein mutiertes HPPD-Enzym kodiert, transformiert werden. Eine Toleranz gegenüber HPPD-Hemmern kann auch dadurch erzielt werden, daß man Pflanzen mit Genen transformiert, die für gewisse Enzyme kodieren, die die Bildung von Homogentisat trotz Hemmung des nativen HPPD-Enzyms durch den
20 HPPD-Hemmer ermöglichen. Die Toleranz von Pflanzen gegenüber HPPD-Hemmern kann auch dadurch verbessert werden, daß man Pflanzen zusätzlich zu einem Gen, das für ein HPPD-tolerantes Enzym kodiert, mit einem Gen transformiert, das für ein Prephenatdehydrogenase-Enzym kodiert.

Weitere herbizidresistente Pflanzen sind Pflanzen, die gegenüber Acetolactatsynthase (ALS)-
25 Hemmern tolerant gemacht worden sind. Zu bekannten ALS-Hemmern zählen zum Beispiel Sulfonylharnstoff, Imidazolinon, Triazolopyrimidine, Pyrimidinyloxy(thio)benzoate und/oder Sulfonylaminocarbonyltriazolinon-Herbizide. Es ist bekannt, daß verschiedene Mutationen im Enzym ALS (auch als Acetohydroxysäure-Synthase, AHAS, bekannt) eine Toleranz gegenüber unterschiedlichen Herbiziden bzw. Gruppen von Herbiziden verleihen. Die Herstellung von
30 sulfonylharnstofftoleranten Pflanzen und imidazolinontoleranten Pflanzen ist in der internationalen Veröffentlichung WO 1996/033270 beschrieben. Weitere sulfonylharnstoff- und imidazolinontolerante Pflanzen sind auch in z.B. WO 2007/024782 beschrieben.

Weitere Pflanzen, die gegenüber Imidazolinon und/oder Sulfonylharnstoff tolerant sind, können durch induzierte Mutagenese, Selektion in Zellkulturen in Gegenwart des Herbizids oder durch
35 Mutationszüchtung erhalten werden.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind insektenresistente transgene Pflanzen, d.h. Pflanzen, die gegen Befall mit gewissen Zielinsekten resistent gemacht wurden. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch
5 Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Insektenresistenz verleiht, erhalten werden.

Der Begriff "insektenresistente transgene Pflanze" umfaßt im vorliegenden Zusammenhang jegliche Pflanze, die mindestens ein Transgen enthält, das eine Kodiersequenz umfaßt, die für folgendes kodiert:

- 10 1) ein insektizides Kristallprotein aus *Bacillus thuringiensis* oder einen insektiziden Teil davon, wie die insektiziden Kristallproteine, die online bei: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/ beschrieben sind, zusammengestellt wurden, oder insektizide Teile davon, z.B. Proteine der Cry-Proteinklassen Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae oder Cry3Bb oder insektizide
15 Teile davon; oder
- 2) ein Kristallprotein aus *Bacillus thuringiensis* oder einen Teil davon, der in Gegenwart eines zweiten, anderen Kristallproteins als *Bacillus thuringiensis* oder eines Teils davon insektizid wirkt, wie das binäre Toxin, das aus den Kristallproteinen Cy34 und Cy35 besteht; oder
- 20 3) ein insektizides Hybridprotein, das Teile von zwei unterschiedlichen insektiziden Kristallproteinen aus *Bacillus thuringiensis* umfaßt, wie zum Beispiel ein Hybrid aus den Proteinen von 1) oben oder ein Hybrid aus den Proteinen von 2) oben, z. B. das Protein Cry1A.105, das von dem Mais-Event MON98034 produziert wird (WO 2007/027777); oder
- 25 4) ein Protein gemäß einem der Punkte 1) bis 3) oben, in dem einige, insbesondere 1 bis 10, Aminosäuren durch eine andere Aminosäure ersetzt wurden, um eine höhere insektizide Wirksamkeit gegenüber einer Zielinsektenart zu erzielen und/oder um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern und/oder wegen Veränderungen, die in die Kodier- DNA während der Klonierung oder Transformation induziert wurden, wie das
30 Protein Cry3Bb1 in Mais-Events MON863 oder MON88017 oder das Protein Cry3A im Mais-Event MIR 604;
- 5) ein insektizides sezerniertes Protein aus *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus* oder einen insektiziden Teil davon, wie die vegetativ wirkenden insektentoxischen Proteine

(vegetative insecticidal proteins, VIP), die unter http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html angeführt sind, z. B. Proteine der Proteinklasse VIP3Aa; oder

- 6) ein sezerniertes Protein aus *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus*, das in Gegenwart
 5 eines zweiten sezernierten Proteins aus *Bacillus thuringiensis* oder *B. cereus* insektizid wirkt, wie das binäre Toxin, das aus den Proteinen VIP1A und VIP2A besteht.
- 7) ein insektizides Hybridprotein, das Teile von verschiedenen sezernierten Proteinen von *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus* umfaßt, wie ein Hybrid der Proteine von 1) oder ein Hybrid der Proteine von 2) oben; oder
- 10 8) ein Protein gemäß einem der Punkte 1) bis 3) oben, in dem einige, insbesondere 1 bis 10, Aminosäuren durch eine andere Aminosäure ersetzt wurden, um eine höhere insektizide Wirksamkeit gegenüber einer Zielinsektenart zu erzielen und/oder um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern und/oder wegen Veränderungen, die in die Kodier- DNA während der Klonierung oder Transformation induziert wurden (wobei die
 15 Kodierung für ein insektizides Protein erhalten bleibt), wie das Protein VIP3Aa im Baumwoll-Event COT 102.

Natürlich zählt zu den insektenresistenten transgenen Pflanzen im vorliegenden Zusammenhang auch jegliche Pflanze, die eine Kombination von Genen umfaßt, die für die Proteine von einer der oben genannten Klassen 1 bis 8 kodieren. In einer Ausführungsform enthält eine insektenresistente
 20 Pflanze mehr als ein Transgen, das für ein Protein nach einer der oben genannten 1 bis 8 kodiert, um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern oder um die Entwicklung einer Resistenz der Insekten gegen die Pflanzen dadurch hinauszuzögern, daß man verschiedene Proteine einsetzt, die für dieselbe Zielinsektenart insektizid sind, jedoch eine unterschiedliche Wirkungsweise, wie Bindung an unterschiedliche Rezeptorbindungsstellen im Insekt, aufweisen.

25 Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind gegenüber abiotischen Streßfaktoren tolerant. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Streßresistenz verleiht, erhalten werden. Zu besonders nützlichen Pflanzen mit Streßtoleranz zählen
 30 folgende:

- a. Pflanzen, die ein Transgen enthalten, das die Expression und/oder Aktivität des Gens für die Poly(ADP-ribose)polymerase (PARP) in den Pflanzenzellen oder Pflanzen zu reduzieren vermag.

- b. Pflanzen, die ein streßtoleranzförderndes Transgen enthalten, das die Expression und/oder Aktivität der für PARG kodierenden Gene der Pflanzen oder Pflanzenzellen zu reduzieren vermag;
- c. Pflanzen, die ein streßtoleranzförderndes Transgen enthalten, das für ein in Pflanzen funktionelles Enzym des Nicotinamidadenindinukleotid-Salvage-Biosynthesewegs kodiert, darunter Nicotinamidase, Nicotinatphosphoribosyltransferase, Nicotinsäuremononukleotid-adenyltransferase, Nicotinamidadenindinukleotidsynthetase oder Nicotinamidphosphoribosyltransferase.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, weisen eine veränderte Menge, Qualität und/oder Lagerfähigkeit des Ernteprodukts und/oder veränderte Eigenschaften von bestimmten Bestandteilen des Ernteprodukts auf, wie zum Beispiel:

- 1) Transgene Pflanzen, die eine modifizierte Stärke synthetisieren, die bezüglich ihrer chemisch-physikalischen Eigenschaften, insbesondere des Amylosegehalts oder des Amylose/Amylopektin-Verhältnisses, des Verzweigungsgrads, der durchschnittlichen Kettenlänge, der Verteilung der Seitenketten, des Viskositätsverhaltens, der Gelfestigkeit, der Stärkekorngröße und/oder Stärkekornmorphologie im Vergleich mit der synthetisierten Stärke in Wildtyppflanzenzellen oder -pflanzen verändert ist, so daß sich diese modifizierte Stärke besser für bestimmte Anwendungen eignet.
- 2) ~~Transgene Pflanzen, die Nichtstärkekohlenhydratpolymere synthetisieren, oder Nichtstärkekohlenhydratpolymere, deren Eigenschaften im Vergleich zu Wildtyppflanzen ohne genetische Modifikation verändert sind.~~ Beispiele sind Pflanzen, die Polyfructose, insbesondere des Inulin- und Levantyps, produzieren, Pflanzen, die alpha-1,4-Glucane produzieren, Pflanzen, die alpha-1,6-verzweigte alpha-1,4-Glucane produzieren und Pflanzen, die Alternan produzieren.
- 3) Transgene Pflanzen, die Hyaluronan produzieren.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit veränderten Fasereigenschaften. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solche veränderten Fasereigenschaften verleiht, erhalten werden; dazu zählen:

- a) Pflanzen wie Baumwollpflanzen, die eine veränderte Form von Cellulosesynthasegenen enthalten,

- b) Pflanzen wie Baumwollpflanzen, die eine veränderte Form von rsw2- oder rsw3-homologen Nukleinsäuren enthalten;
- c) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit einer erhöhten Expression der Saccharosephosphatsynthase;
- 5 d) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit einer erhöhten Expression der Saccharosesynthase;
- e) Pflanzen wie Baumwollpflanzen bei denen der Zeitpunkt der Durchlaßsteuerung der Plasmodesmen an der Basis der Faserzelle verändert ist, z. B. durch Herunterregulieren der faserselektiven β -1,3-Glucanase;
- 10 f) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit Fasern mit veränderter Reaktivität, z. B. durch Expression des N-Acetylglucosamintransferasegens, darunter auch nodC, und von Chitinsynthasegenen.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind
 15 Pflanzen wie Raps oder verwandte Brassica-Pflanzen mit veränderten Eigenschaften der Ölzusammensetzung. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solche veränderten Öleigenschaften verleiht, erhalten werden; dazu zählen:

- a) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem hohen Ölsäuregehalt produziere;
- 20 b) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem niedrigen Linolensäuregehalt produzieren.
- c) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem niedrigen gesättigten Fettsäuregehalt produzieren.

Besonders nützliche transgene Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind
 25 Pflanzen mit einem oder mehreren Genen, die für ein oder mehrere Toxine kodieren, sind die transgenen Pflanzen, die unter den folgenden Handelsbezeichnungen angeboten werden: YIELD GARD® (zum Beispiel Mais, Baumwolle, Sojabohnen), KnockOut® (zum Beispiel Mais), BiteGard® (zum Beispiel Mais), BT-Xtra® (zum Beispiel Mais), StarLink® (zum Beispiel Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle), Nucotn 33B® (Baumwolle), NatureGard® (zum
 30 Beispiel Mais), Protecta® und NewLeaf® (Kartoffel). Herbizidtolerante Pflanzen, die zu erwähnen sind, sind zum Beispiel Maissorten, Baumwollsorten und Sojabohnensorten, die unter den

folgenden Handelsbezeichnungen angeboten werden: Roundup Ready® (Glyphosatetoleranz, zum Beispiel Mais, Baumwolle, Sojabohne), Liberty Link® (Phosphinotricintoleranz, zum Beispiel Raps), IMI® (Imidazolinontoleranz) und SCS® (Sylfonylharnstofftoleranz), zum Beispiel Mais. Zu den herbizidresistenten Pflanzen (traditionell auf Herbizidtoleranz gezüchtete Pflanzen), die zu
5 erwähnen sind, zählen die unter der Bezeichnung Clearfield® angebotenen Sorten (zum Beispiel Mais).

Besonders nützliche transgene Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen, die Transformations-Events, oder eine Kombination von Transformations-Events, enthalten und die zum Beispiel in den Dateien von verschiedenen nationalen oder regionalen
10 Behörden angeführt sind (siehe zum Beispiel http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx und <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffkombinationen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln,
15 Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Saatgut, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Insbesondere eignen sich die erfindungsgemäßen Mischungen zur Behandlung von Saatgut. Bevorzugt sind dabei die vorstehend als bevorzugt oder besonders bevorzugt genannten erfindungsgemäßen Kombinationen zu nennen. So entsteht ein großer Teil des durch Schädlinge
20 verursachten Schadens an Kulturpflanzen bereits durch den Befall des Saatguts während der Lagerung und nach dem Einbringen des Saatguts in den Boden sowie während und unmittelbar nach der Keimung der Pflanzen. Diese Phase ist besonders kritisch, da die Wurzeln und Sprosse der wachsenden Pflanze besonders empfindlich sind und bereits ein geringer Schaden zum Absterben der ganzen Pflanze führen kann. Es besteht daher ein insbesondere großes Interesse
25 daran, das Saatgut und die keimende Pflanze durch den Einsatz geeigneter Mittel zu schützen.

Die Bekämpfung von Schädlingen durch die Behandlung des Saatguts von Pflanzen ist seit langem bekannt und ist Gegenstand ständiger Verbesserungen. Dennoch ergeben sich bei der Behandlung von Saatgut eine Reihe von Problemen, die nicht immer zufriedenstellend gelöst werden können. So ist es erstrebenswert, Verfahren zum Schutz des Saatguts und der keimenden Pflanze zu
30 entwickeln, die das zusätzliche Ausbringen von Pflanzenschutzmitteln nach der Saat oder nach dem Auflaufen der Pflanzen überflüssig machen. Es ist weiterhin erstrebenswert, die Menge des eingesetzten Wirkstoffs dahingehend zu optimieren, dass das Saatgut und die keimende Pflanze vor dem Befall durch Schädlinge bestmöglich geschützt wird, ohne jedoch die Pflanze selbst durch den eingesetzten Wirkstoff zu schädigen. Insbesondere sollten Verfahren zur Behandlung von Saatgut

auch die intrinsischen insektiziden Eigenschaften transgener Pflanzen einbeziehen, um einen optimalen Schutz des Saatguts und auch der keimenden Pflanze bei einem minimalen Aufwand an Pflanzenschutzmitteln zu erreichen.

Die vorliegende Erfindung bezieht sich daher insbesondere auch auf ein Verfahren zum Schutz von
5 Saatgut und keimenden Pflanzen vor dem Befall von Schädlingen, indem das Saatgut mit einem erfindungsgemäßen Mittel behandelt wird. Die Erfindung bezieht sich ebenfalls auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Mittel zur Behandlung von Saatgut zum Schutz des Saatguts und der daraus entstehenden Pflanze vor Schädlingen. Weiterhin bezieht sich die Erfindung auf Saatgut, welches zum Schutz vor Schädlingen mit einem erfindungsgemäßen Mittel behandelt
10 wurde.

Einer der Vorteile der vorliegenden Erfindung ist es, dass aufgrund der besonderen systemischen Eigenschaften der erfindungsgemäßen Mittel die Behandlung des Saatguts mit diesen Mitteln nicht nur das Saatgut selbst, sondern auch die daraus hervorgehenden Pflanzen nach dem Auflaufen vor Schädlingen schützt. Auf diese Weise kann die unmittelbare Behandlung der Kultur zum Zeitpunkt
15 der Aussaat oder kurz danach entfallen.

Ein weiterer Vorteil besteht in der synergistischen Erhöhung der insektiziden Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Mittel gegenüber dem insektiziden Einzelwirkstoff, die über die zu erwartende Wirksamkeit der beiden einzeln angewendeten Wirkstoffe hinausgeht. Vorteilhaft ist auch die synergistische Erhöhung der fungiziden Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Mittel gegenüber
20 dem fungiziden Einzelwirkstoff, die über die zu erwartende Wirksamkeit des einzeln angewendeten Wirkstoffs hinausgeht. Damit wird eine Optimierung der Menge der eingesetzten Wirkstoffe ermöglicht.

Ebenso ist es als vorteilhaft anzusehen, dass die erfindungsgemäßen Mischungen insbesondere auch bei transgenem Saatgut eingesetzt werden können, wobei die aus diesem Saatgut hervor-
25 gehenden Pflanzen zur Expression eines gegen Schädlinge gerichteten Proteins befähigt sind. Durch die Behandlung solchen Saatguts mit den erfindungsgemäßen Mitteln können bestimmte Schädlinge bereits durch die Expression des z.B. insektiziden Proteins kontrolliert werden, und zusätzlich durch die erfindungsgemäßen Mittel vor Schäden bewahrt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich zum Schutz von Saatgut jeglicher Pflanzensorte wie
30 bereits vorstehend genannt, die in der Landwirtschaft, im Gewächshaus, in Forsten oder im Gartenbau eingesetzt wird. Insbesondere handelt es sich dabei um Saatgut von Mais, Erdnuss, Canola, Raps, Mohn, Soja, Baumwolle, Rübe (z.B. Zuckerrübe und Futterrübe), Reis, Hirse, Weizen, Gerste, Hafer, Roggen, Sonnenblume, Tabak, Kartoffeln oder Gemüse (z.B. Tomaten, Kohlgewächs). Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich ebenfalls zur Behandlung des Saatguts

von Obstpflanzen und Gemüse wie vorstehend bereits genannt. Besondere Bedeutung kommt der Behandlung des Saatguts von Mais, Soja, Baumwolle, Weizen und Canola oder Raps zu.

Wie vorstehend bereits erwähnt, kommt auch der Behandlung von transgenem Saatgut mit einem erfindungsgemäßen Mittel eine besondere Bedeutung zu. Dabei handelt es sich um das Saatgut von
5 Pflanzen, die in der Regel zumindest ein heterologes Gen enthalten, das die Expression eines Polypeptids mit insbesondere insektiziden Eigenschaften steuert. Die heterologen Gene in transgenem Saatgut können dabei aus Mikroorganismen wie *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* oder *Gliocladium* stammen. Die vorliegende Erfindung eignet sich besonders für die Behandlung von transgenem Saatgut, das zumindest ein heterologes Gen
10 enthält, das aus *Bacillus sp.* stammt und dessen Genprodukt Wirksamkeit gegen Maiszünsler und/oder Maiswurzel-Bohrer zeigt. Besonders bevorzugt handelt es sich dabei um ein heterologes Gen, das aus *Bacillus thuringiensis* stammt.

Im Rahmen der vorliegenden Erfindung wird das erfindungsgemäße Mittel alleine oder in einer geeigneten Formulierung auf das Saatgut aufgebracht. Vorzugsweise wird das Saatgut in einem
15 Zustand behandelt, in dem so stabil ist, dass keine Schäden bei der Behandlung auftreten. Im Allgemeinen kann die Behandlung des Saatguts zu jedem Zeitpunkt zwischen der Ernte und der Aussaat erfolgen. Üblicherweise wird Saatgut verwendet, das von der Pflanze getrennt und von Kolben, Schalen, Stängeln, Hülle, Wolle oder Fruchtfleisch befreit wurde.

Im Allgemeinen muss bei der Behandlung des Saatguts darauf geachtet werden, dass die Menge
20 des auf das Saatgut aufgebrachten erfindungsgemäßen Mittels und/oder weiterer Zusatzstoffe so gewählt wird, dass die Keimung des Saatguts nicht beeinträchtigt bzw. die daraus hervorgehende Pflanze nicht geschädigt wird. Dies ist vor allem bei Wirkstoffen zu beachten, die in bestimmten Aufwandmengen phytotoxische Effekte zeigen können.

Darüber hinaus können die erfindungsgemäßen Verbindungen zur Bekämpfung einer Vielzahl
25 verschiedener Schädlinge einschließlich beispielsweise schädlicher saugender Insekten, beißender Insekten und anderen an Pflanzen parasitierenden Schädlingen, Vorratsschädlingen, Schädlingen, die industrielle Materialien zerstören und Hygieneschädlingen einschließlich Parasiten im Bereich Tiergesundheit verwendet und zu ihrer Bekämpfung wie zum Beispiel ihrer Auslöschung und Ausmerzung eingesetzt werden. Die vorliegende Erfindung schließt somit auch ein Verfahren zur
30 Bekämpfung von Schädlingen ein.

Im Bereich Tiergesundheit, d.h. auf dem veterinärmedizinischen Gebiet, wirken die Wirkstoffe gemäß der vorliegenden Erfindung gegen tierische Parasiten, insbesondere Ektoparasiten oder Endoparasiten. Der Begriff Endoparasiten schließt insbesondere Helminthen wie Cestoden, Nematoden oder Trematoden, und Protozoen wie Kozzidien ein. Ektoparasiten sind typischerweise

und vorzugsweise Arthropoden, insbesondere Insekten wie Fliegen (stechend und leckend), parasitische Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge, Flöhe und dergleichen; oder Akariden wie Zecken, zum Beispiel Schildzecken oder Lederzecken, oder Milben wie Räudemilben, Laufmilben, Federmilben und dergleichen.

5 Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; spezielle Beispiele sind: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus*
10 *humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen *Amblycerina* und *Ischnocerina* z.B. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; spezielle Beispiele sind: *Bovicola bovis*,
15 *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*;

Aus der Ordnung der Diptera und den Unterordnungen *Nematocera* und *Brachycera* z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus*
20 ~~spp.~~, ~~Tabanus spp.~~, ~~Haematopota spp.~~, ~~Philipomyia spp.~~, ~~Braula spp.~~, ~~Musca spp.~~, ~~Hydrotaea spp.~~, *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; spezielle Beispiele sind: *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles*
25 *gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Simulium reptans*, *Phlebotomus papatasi*, *Phlebotomus longipalpis*, *Odagmia ornata*, *Wilhelmia equina*, *Boophthora erythrocephala*, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Hybomitra ciurea*,
30 *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Haematopota pluvialis*, *Haematopota italica*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Haematobia irritans irritans*, *Haematobia irritans exigua*, *Haematobia stimulans*, *Hydrotaea irritans*, *Hydrotaea albipuncta*, *Chrysomya chloropyga*, *Chrysomya bezziana*, *Oestrus ovis*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Przhevalskiana silenus*, *Dermatobia hominis*, *Melophagus ovinus*, *Lipoptena capreoli*, *Lipoptena cervi*, *Hippobosca*
35 *variegata*, *Hippobosca equina*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gasterophilus haemorrhoidalis*,

Gasterophilus inermis, *Gasterophilus nasalis*, *Gasterophilus nigricornis*, *Gasterophilus pecorum*,
Braula coeca;

Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp.,
Xenopsylla spp., *Ceratophyllus* spp.; spezielle Beispiele sind: *Ctenocephalides canis*,
5 *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus*
spp.

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*,
Supella spp. (z.B. *Supella longipalpa*);

10 Aus der Unterklasse der Acari (Acarina) und den Ordnungen der Meta- und Mesostigmata z.B.
Argas spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus*
(*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp.,
Rhipicephalus spp. (der ursprünglichen Gattung der Mehrwirtszecken), *Ornithonyssus* spp.,
Pneumonyssus spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis*
15 spp.; spezielle Beispiele sind: *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius*
megnini, *Rhipicephalus (Boophilus) microplus*, *Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*,
Rhipicephalus (Boophilus) annulatus, *Rhipicephalus (Boophilus) calceratus*, *Hyalomma*
anatolicum, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus*
evertsi, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*,
20 ~~*Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis punctata*,~~
Haemaphysalis cinnabarina, *Haemaphysalis otophila*, *Haemaphysalis leachi*, *Haemaphysalis*
longicornis, *Dermacentor marginatus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor pictus*, *Dermacentor*
albipictus, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma mauritanicum*,
Rhipicephalus sanguineus, *Rhipicephalus bursa*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus*
25 *capensis*, *Rhipicephalus turanicus*, *Rhipicephalus zambeziensis*, *Amblyomma americanum*,
Amblyomma variegatum, *Amblyomma maculatum*, *Amblyomma hebraeum*, *Amblyomma*
cajennense, *Dermanyssus gallinae*, *Ornithonyssus bursa*, *Ornithonyssus sylviarum*, *Varroa*
jacobsoni;

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. *Acarapis* spp.,
30 *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula*
spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp.,
Pterolichus spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp.,
Knemidocoptes spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.; spezielle Beispiele sind: *Cheyletiella*
yasguri, *Cheyletiella blakei*, *Demodex canis*, *Demodex bovis*, *Demodex ovis*, *Demodex caprae*,

Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrombicula autumnalis, Neotrombicula desaleri, Neoschöngastia xerothermobia, Trombicula akamushi, Otodectes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae (=S. caprae), Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis, Psoergates ovis, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, Helminthen und Protozoen, die Tiere befallen. Zu den Tieren zählen landwirtschaftliche Nutztiere wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Zuchtfische, Honigbienen. Zu den Tieren zählen außerdem Haustiere – die auch als Heimtiere bezeichnet werden – wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse.

Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden, Helminthen und/oder Protozoen sollen Todesfälle vermindert und die Leistung (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) und die Gesundheit des Wirtstieres verbessert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

So ist es beispielsweise wünschenswert, die Aufnahme von Blut des Wirts durch die Parasiten (falls zutreffend) zu verhindern oder zu unterbrechen. Eine Bekämpfung der Parasiten kann außerdem dazu beitragen, die Übertragung infektiöser Substanzen zu verhindern.

Der Begriff "Bekämpfung", so wie er hier bezogen auf den Bereich Tiergesundheit verwendet wird, bedeutet, dass die Wirkstoffe wirken, indem sie das Vorkommen des betreffenden Parasiten in einem mit solchen Parasiten befallenen Tier auf unschädliche Niveaus reduzieren. Genauer gesagt bedeutet "Bekämpfung", wie hier verwendet, dass der Wirkstoff den betreffenden Parasiten tötet, sein Wachstum hemmt oder seine Proliferation inhibiert.

Im allgemeinen können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe, wenn sie für die Behandlung von Tieren eingesetzt werden, direkt angewendet werden. Vorzugsweise werden sie als pharmazeutische Zusammensetzungen angewendet, die im Stand der Technik bekannte pharmazeutisch unbedenkliche Exzipienten und/oder Hilfsstoffe enthalten können.

Die Anwendung (= Verabreichung) der Wirkstoffe im Bereich Tiergesundheit und in der Tierhaltung erfolgt in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subkutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Applikation in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens

(Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw. Die Wirkstoffe können als Shampoo oder als geeignete, in Aerosolen oder drucklosen Sprays, z.B. Pumpsprays und
5 Zerstäubersprays, anwendbare, Formulierungen formuliert werden.

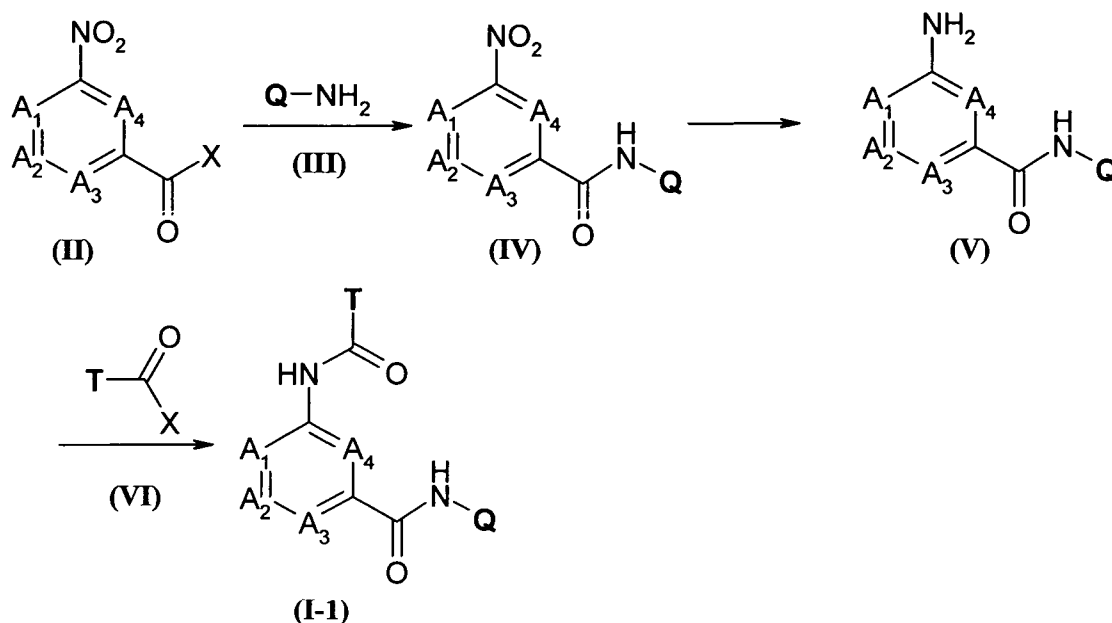
Bei der Anwendung für Nutztiere, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Spritzpulver [wetable powders, "WP"], Emulsionen, Emulsionskonzentrate [emulsifiable concentrates, "EC"], fließfähige Mittel, homogene Lösungen und Suspensionskonzentrate [suspension concentrates, "SC"]), die die
10 Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach Verdünnung (z.B. 100- bis 10 000facher Verdünnung) anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Beim Einsatz im Bereich Tiergesundheit können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Kombination mit geeigneten Synergisten oder anderen Wirkstoffen wie beispielsweise Akariziden, Insektiziden, Anthelmintika, Mittel gegen Protozoen, verwendet werden.

15 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können nach üblichen, dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können nach üblichen, dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden.

Im Reaktionsschema 1 ist das allgemeine Darstellungsverfahren A für die erfindungsgemäßen
20 Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1) abgebildet.

Reaktionsschema 1

In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (I-1), (II), (III), (IV), (V) und (VI) im Reaktionsschema 1 haben die chemischen Gruppierungen A₁, A₂, A₃ und A₄ sowie die Reste Q und T die weiter oben beschriebenen Bedeutungen. In den allgemeinen Formeln (II) und (VI) steht X für eine geeignete Abgangsgruppe.

Erfindungsgemäße Verbindungen des Typs (I-1) können durch die Umsetzung von (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (V) mit aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (VI) dargestellt werden. Die Reaktion kann gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels durchgeführt werden. In diesem Reaktionsschritt kann gegebenenfalls ein geeignetes basisches Reaktionshilfsmittel zum Einsatz kommen.

Mischungen der Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel sind ebenfalls einsetzbar. Die Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel werden vorteilhafterweise in einer solchen Menge eingesetzt, dass das Reaktionsgemisch während des ganzen Verfahrens gut rührbar ist.

Als Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren kommen grundsätzlich alle unter den spezifischen Reaktionsbedingungen inerten organischen Lösungsmittel in Frage. Als Beispiele sind zu nennen: Halogenkohlenwasserstoffe (z.B. Chlorkohlenwasserstoffe, wie Tetraethylen, Tetrachlorethan, Dichlorpropan, Methylenechlorid, Dichlorbutan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Trichlorethan, Trichlorethylen, Pentachlorethan, Difluorbenzol, 1,2-Dichlorethan, Chlorbenzol, Brombenzol, Dichlorbenzol, Chlortoluol, Trichlorbenzol), Alkohole (z.B. Methanol, Ethanol, Isopropanol, Butanol), Ether (z.B. Ethylpropylether, Methyl-tert-butylether, n-Butylether, Anisol, Phenetol, Cyclohexylmethylether,

Dimethylether, Diethylether, Dipropylether, Diisopropylether, Di-n-butylether, Diisobutylether, Diisoamylether, Ethylenglycoldimethylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dichlordiethylether und Polyether des Ethylenoxids und/oder Propylenoxids), Amine (z.B. Trimethyl-, Triethyl-, Tripropyl-, Tributylamin, N-Methylmorpholin, Pyridin und Tetramethylendiamin), Nitrokohlenwasserstoffe (z.B. Nitromethan, Nitroethan, Nitropropan, Nitrobenzol, Chlornitrobenzol, o-Nitrotoluol; Nitrile wie Acetonitril, Propionitril, Butyronitril, Isobutyronitril, Benzonitril, m-Chlorbenzonitril), Tetrahydrothiophendioxid, Dimethylsulfoxid, Tetramethylsulfoxid, Dipropylsulfoxid, Benzylmethylsulfoxid, Diisobutylsulfoxid, Dibutylsulfoxid, Diisoamylsulfoxid, Sulfone (z.B. Dimethyl-, Diethyl-, Dipropyl-, Dibutyl-, Diphenyl-, Dihexyl-, Methylethyl-, Ethylpropyl-, Ethylisobutyl- und Pentamethylensulfon), aliphatische, cycloaliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe (z.B. Pentan, Hexan, Heptan, Oktan, Nonan und technische Kohlenwasserstoffe), ferner sogenannte "White Spirits" mit Komponenten mit Siedepunkten im Bereich von beispielsweise 40°C bis 250°C, Cymol, Benzinfraktionen innerhalb eines Siedeinteralles von 70°C bis 190°C, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Petrolether, Ligroin, Octan, Benzol, Toluol, Chlorbenzol, Brombenzol, Nitrobenzol, Xylol, Ester (z.B. Methyl-, Ethyl-, Butyl-, Isobutylacetat, Dimethyl-, Dibutyl-, Ethylencarbonat); Amide (z.B. Hexamethylenphosphorsäuretriamid, Formamid, N-Methyl-formamid, N,N-Dimethyl-formamid, N,N-Dipropyl-formamid, N,N-Dibutyl-formamid, N-Methyl-pyrrolidin, N-Methyl-caprolactam, 1,3-Dimethyl-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pyrimidin, Octylpyrrolidon, Octylcaprolactam, 1,3-Dimethyl-2-imidazolindion, N-Formyl-piperidin, N,N'-1,4-Diformyl-piperazin) und Ketone (z.B. Aceton, Acetophenon, Methylethylketon, Methylbutylketon).

Als bevorzugte Verdünnungsmittel kann jedes Lösungsmittel verwendet werden, das die Reaktion nicht beeinträchtigt, wie zum Beispiel Wasser. In Frage kommen aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol oder Toluol; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan, Chloroform oder Tetrachlorkohlenwasserstoff, offenkettige oder zyklische Ether wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder 1,2-Dimethoxyethan; Ester wie Ethylacetat und Butylacetat; Ketone wie zum Beispiel Aceton, Methyl-isobutylketon und Cyclohexanon; Amide wie Dimethylformamid und Dimethylacetamid; Nitrile wie Acetonitril; und andere inerte Lösungsmittel wie 1,3-Dimethyl-2-imidazolindion; die Lösungsmittel können allein oder in Kombination von 2 oder mehr eingesetzt werden.

Als basische Reaktionshilfsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens können alle geeigneten Säurebindemittel eingesetzt werden. Als Beispiele sind zu nennen Erdalkali- oder Alkalimetallverbindungen (z.B. Hydroxide, Hydride, Oxide und Carbonate des Lithiums, Natriums, Kaliums, Magnesiums, Calciums und Bariums), Amidinbasen oder Guanidinbasen (z.B. 7-Methyl-1,5,7-triaza-bicyclo(4.4.0)dec-5-en (MTBD); Diazabicyclo(4.3.0)nonen (DBN), Diazabicyclo(2.2.2)octan (DABCO), 1,8-Diazabicyclo(5.4.0)undecen (DBU), Cyclohexyltetra-

butyl-guanidin (CyTBG), Cyclohexyltetramethylguanidin (CyTMG), N,N,N,N-Tetramethyl-1,8-naphthalindiamin, Pentamethylpiperidin) und Amine, insbesondere tertiäre Amine, (z.B. Triethylamin, Trimethylamin, Tribenzylamin, Triisopropylamin, Tributylamin, Tricyclohexylamin, Triamylamin, Trihexylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-toluidin, N,N-Dimethyl-p-aminopyridin, N-Methyl-pyrrolidin, N-Methyl-piperidin, N-Methyl-imidazol, N-Methyl-pyrazol, N-Methyl-morpholin, N-Methyl-hexamethylendiamin, Pyridin, 4-Pyrrolidinopyridin, 4-Dimethyl-amino-pyridin, Chinolin, α -Picolin, β -Picolin, Isochinolin, Pyrimidin, Acridin, N,N,N',N'-Tetra-methylendiamin, N,N,N',N'-Tetraethylendiamin, Chinoxalin, N-Propyl-diisopropylamin, N-Ethyl-diisopropylamin, N,N'-Dimethyl-cyclohexylamin, 2,6-Lutidin, 2,4-Lutidin oder Triethyldiamin).

10 Als bevorzugtes basisches Reaktionshilfsmittel kann eine organische Base wie Triethylamin, Ethyl-diisopropylamin, Tri-n-butylamin, Pyridin und 4-Dimethylamino-pyridin verwendet werden; Des Weiteren können beispielsweise folgende Basen eingesetzt werden: Alkalimetallhydroxide wie z.B. Natriumhydroxid und Kaliumhydroxid; Carbonate wie Natriumhydrogencarbonat und Kaliumcarbonat; Phosphate wie Dikalium-hydrogenphosphat und Tri-natriumphosphat; 15 Alkalimetallhydride wie Natriumhydrid; Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat und Natriumethanolat. Diese basischen Reaktionshilfsmittel können in Verhältnissen von 0.01 bis 5.0 Moläquivalenten in Bezug auf die Verbindungen der Formel (V) und (VI) eingesetzt werden. Des Weiteren kann auch Silber(I)cyanid als Base und Aktivator eingesetzt werden [Journal of Organic Chemistry. **1992**, 57, 4394-4400; Journal of Medicinal Chemistry **1992**, 35, 3905-3918; Journal of 20 Organic Chemistry **2003**, 68, 1843-1851]

Die geeignete Reaktionstemperatur liegt im Bereich von -20°C bis zum Siedepunkt des jeweiligen Lösungsmittels und die Reaktionsdauer liegt je nach Wahl der Reaktanden, Lösungsmittel und Reaktionstemperatur zwischen wenigen Minuten bis 96 Stunden.

25 Carbonsäurehalogenide ($X = \text{Halogen}$), wie sie durch die allgemeine Formel (VI) repräsentiert werden, können in üblicher Art und Weise durch die Umsetzung einer Carbonsäure mit geeigneten Halogenierungsreagenzien erhalten werden. Beispielsweise können anorganische Säurehalogenide wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Oxalylchlorid, Phosphortri- oder Phosphorpentahalogenide für die Halogenierungsreaktion verwendet werden, wobei die Chloride bevorzugt sind [Houben-Weyl, 30 Methoden der organischen Chemie, Bd. VIII, 4. Auflage, 1952, G. Thieme Verlag Stuttgart-New York, S. 359, 463 ff.].

Die Darstellung von Carboxamiden repräsentiert durch die Formel (I-1) kann aber auch unter der Verwendung von Kupplungsreagenzien durchgeführt werden. Als Kupplungsreagenzien finden alle, die zur Herstellung einer Ester- oder Amidbindung geeignet sind (vgl. z. B. Houben-Weyl,

Methoden der Organischen Chemie, Band 15/2; Bodansky et al., Peptide Synthesis 2nd ed. (Wiley & Sons, New York 1976) oder Gross, Meienhofer, The Peptides: Analysis, Synthesis, Biology (Academic Press, New York 1979), Verwendung. Vorzugsweise werden folgende Methoden herangezogen: Aktivestermethode mit Pentachlor (Pcp) und Pentafluorphenol (Pfp), N-Hydroxysuccinimid (HOSu), N-Hydroxy-5-norbornen-2,3-dicarboxamid (HONB), 1-Hydroxybenzotriazol (HOBt) oder 3-Hydroxy-4-oxo-3,4-dihydro-1,2,3-benzotriazin als Alkoholkomponente, Kupplung mit Carbodiimiden wie N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-ethylcarbodiimid oder Dicyclohexylcarbodiimid (DCCI), nach dem DCC-Additiv-Verfahren, oder mit n-Propanphosphonsäureanhydrid (PPA) und Gemischt-Anhydrid-Methode mit Pivaloylchlorid, Ethyl- (EEDQ) und Isobutylchlorformiat (IIDQ) oder Kupplung mit Phosphoniumreagenzien, wie Benzotriazol-1-yl-oxy-tris(dimethylaminophosphonium)hexafluorophosphat (BOP), Bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)-phosphonium-säurechlorid (BOP-Cl), Benzotriazol-1-yl-trispyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat (PyBOP[®]) Bromo-tris-pyrrolidino-phosphoniumhexafluorophosphat (PyBroP[®]) oder mit Phosphonsäurereagenzien, wie Cyanphosphon-säurediethylester (DEPC) und Diphenylphosphorylazid (DPPA), Uronium-reagenzien, wie 2-(1H-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetramethyluronium-tetrafluoroborat (TNTU), 2-(2-Oxo-1(2H)-pyridyl)-1,1,3,3-bis-pentamethylentetramethyluronium-tetrafluoroborat (TOPPipU), O-(N-Succinimidyl-1,1,3,3-tetramethyluronium-tetrafluoroborat (TSTU) oder wie 2-(1H-Benzo-triazol-1-yl)-1,1,3,3-tetramethyluronium-hexafluorophosphat (HBTU) oder Reagenzien vom Onium Typ, wie beispielsweise 1-Ethyl-2-fluoropyridiniumtetrafluoroborat (FEP) oder Reagenzien vom Hetarylcarbonyl Typ wie beispielsweise 1,1'-Carbonyl-1H-imidazol.

Verbindungen der allgemeinen Formel (V) können durch eine Reduktionsreaktion aus Verbindungen der allgemeinen Formel (IV) hergestellt werden. Geeignete Verfahren für solche Reduktionen sind Hydrierungen und Metall-vermittelte Reaktionen wie z.B. durch Zinn(II)chlorid, Eisenpulver, Zinkpulver und diesen ähnliche Verbindungen.

Hydrierungen können in einem geeigneten Lösungsmittel in Anwesenheit eines Katalysators unter Wasserstoffatmosphäre (Normaldruck oder Hochdruck). Als geeignete Katalysatoren zur Durchführung der katalytischen Hydrierung kommen alle üblichen Hydrierkatalysatoren, wie beispielsweise Platin-Katalysatoren (Platin-Platte, Platin-Schwamm, Platin-Schwarz, kolloidales Platin, Platinoxid, Platindraht usw.), Palladium-Katalysatoren (beispielsweise Palladium-Schwamm, Palladium-Schwarz, Palladiumoxid, Palladium-Kohle, kolloidales Palladium, Palladium-Bariumsulfat, Palladium-Bariumcarbonat, Palladium-Hydroxid usw.), Nickel-Katalysatoren beispielsweise reduziertes Nickel, Nickeloxid, Raney-Nickel usw.), Ruthenium-Katalysatoren, Cobalt-Katalysatoren (beispielsweise reduziertes Cobalt, Raney-Cobalt usw.), Kupfer-Katalysatoren (beispielsweise reduziertes Kupfer, Raney-Kupfer, Ullmann-Kupfer usw.) in Frage. Vorzugsweise verwendet man jedoch Edelmetallkatalysatoren, wie beispielsweise Platin-

und Palladium- oder Ruthenium-Katalysatoren gegebenenfalls auf einem geeigneten Träger wie beispielsweise auf Kohlenstoff oder Silizium, Rhodium-Katalysatoren, wie beispielsweise Tris(triphenylphosphin)rhodium(I)-chlorid in Gegenwart von Triphenylphosphin.

Selbstverständlich kann durch Verwendung eines „chiralen Hydrierkatalysators“ z. B. mit chiralen
5 Diphosphinliganden, beispielsweise (2*S*,3*S*)-(-)-2,3-Bis(diphenylphosphino)-butan [(*S*,*S*)-
Chiraphos] (N. K. Roberts in „Catalytic Aspects of Metal Phosphine Complexes“, ACS
Washington, S. 337 (1982)) oder (*R*)-(+)-2,2'- bzw. (*S*)-(-)-2,2'-Bis(diphenylphosphino)-1,1'-
binaphthalin [*R*(+)-BINAP bzw. *S*(-)-BINAP] (vgl. A. Miyashita et al. Tetrahedron 40, 1245
10 (1984)) auch der Anteil eines Isomers im Isomerengemisch deutlich erhöht werden bzw. lässt sich
das Entstehen eines weiteren Isomers sogar vollständig unterdrücken.

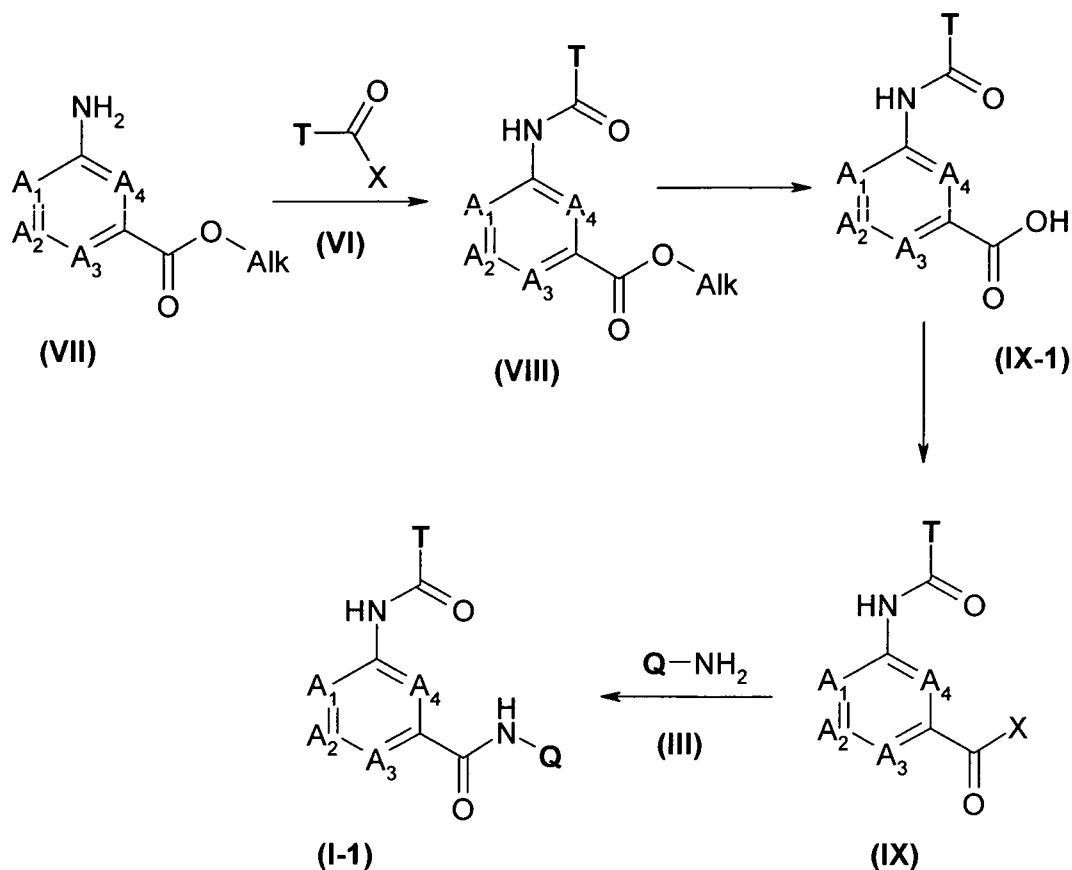
Bevorzugt verwendet man Palladiumkatalysatoren wie z.B. Palladium auf Kohle,
Nickelkatalysatoren wie Raney-Nickel, Kobaltkatalysatoren, Rutheniumkatalysatoren,
Rhodiumkatalysatoren, Platinkatalysatoren und diesen ähnliche Verbindungen.

Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, Alkohole wie Methanol und Ethanol, aromatische
15 Kohlenwasserstoffe wie Benzol und Toluol, offenkettige oder zyklische Ether wie Diethylether,
Dioxan und Tetrahydrofuran sowie Ester wie Essigsäureethylester. Die Reduktionen können in
einem Druckbereich von 1 bar bis 100 bar durchgeführt werden, wobei die Temperatur zwischen -
20°C und dem Siedepunkt des eingesetzten Lösungsmittels variieren kann. Je nach
Reaktionsbedingungen liegen die Reaktionszeiten zwischen wenigen Minuten und 96 Stunden.

20 Die Metall-vermittelten Reduktionen wie z.B. mit Zinn(II)chlorid können nach einem in Organic
Syntheses Coll. Vol. (III), 453 beschriebenen Verfahren durchgeführt werden.

Verbindungen der allgemeinen Formel (IV) können durch die Umsetzung eines Amins der
allgemeinen Formel (III) mit aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (II)
dargestellt werden. Dabei gelten dieselben Bedingungen für die Wahl des Lösungsmittels, der
25 Reaktionsbedingungen, der Reaktionsdauer und der Reagenzien wie bei der oben beschriebenen
Darstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1).

Das Reaktionsschema 2 zeigt das allgemeine Darstellungsverfahren B für die Synthese der
erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1).

Reaktionsschema 2

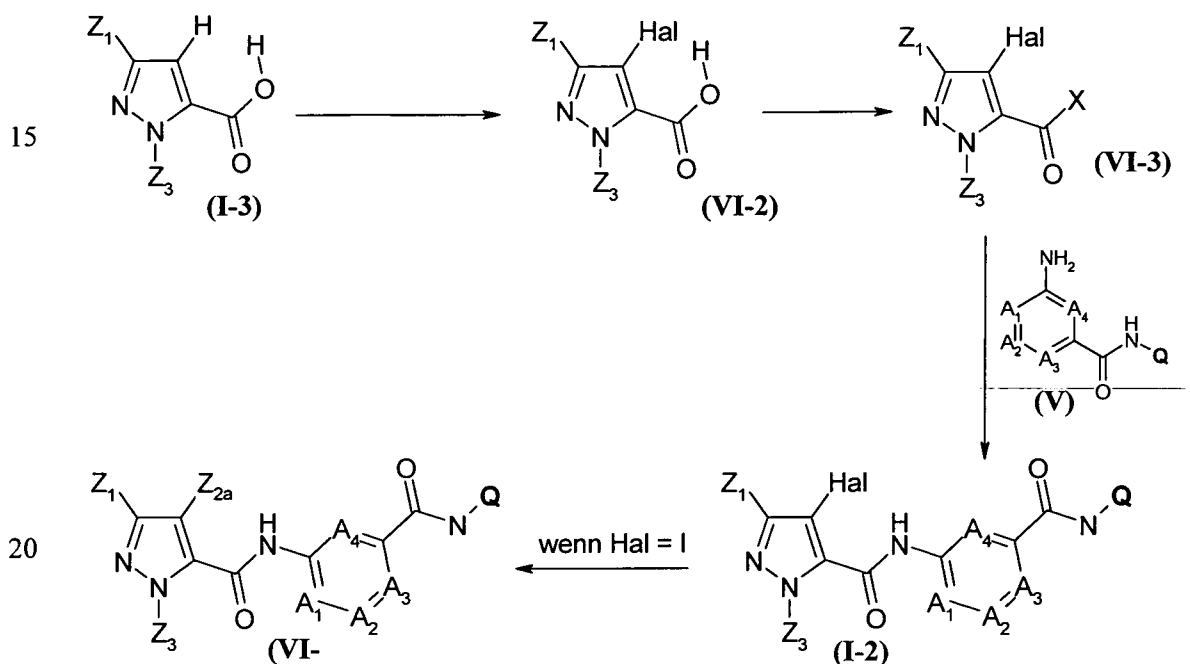
In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (I-1), (III), (VI), (VII), (VIII), (IX-1) und (IX) im Reaktionsschema 2 haben die chemischen Gruppierungen A_1, A_2, A_3 und A_4 sowie die Reste Q und T die weiter oben beschriebenen Bedeutungen. In den allgemeinen Formeln (VI) und (IX) steht X für eine geeignete Abgangsgruppe und „Alk“ für einen geeigneten Alkylrest, wie z.B. Methyl oder Ethyl.

Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1) können durch die Umsetzung einer (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (VII) mit aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (IX) dargestellt werden. Dabei gelten dieselben Bedingungen für die Wahl des Lösungsmittels, der Reaktionsbedingungen, der Reaktionsdauer und der Reagenzien wie bei der im Darstellungsverfahren A beschriebenen Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Formeln (V) und (VI) zu (I-1).

Die Darstellung von aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (IX) kann durch eine zweistufige Synthese aus den entsprechenden Carbonsäureestern der allgemeinen Formel (VIII) erfolgen. Im ersten Reaktionsschritt wird die in Form eines Carbonsäureesters geschützte Carbonsäurefunktion (O-Alk) der Verbindung (VIII) in Abhängigkeit des verwendeten Alkylesters mit einem geeigneten Reagenz entschützt [Greene's protective groups in organic synthesis, 4.

- Edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey] und die daraus resultierende freie Hydroxygruppe der Säurefunktion von (IX-1) in eine geeignete Abgangsgruppe X überführt. Dabei können dieselben Verfahren eingesetzt werden, die bereits in der Darstellung von (VI) beschrieben wurden. Verbindungen der allgemeinen Formel (VIII)
- 5 können durch die Umsetzung von (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (VII) mit aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (VI) dargestellt werden. Dabei gelten dieselben Bedingungen für die Wahl des Lösungsmittels, der Reaktionsbedingungen, der Reaktionsdauer, der Reagenzien wie bei der im Darstellungsverfahren A beschriebenen Synthese von Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1).
- 10 Wenn es sich bei den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) um Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-2) und (I-3) handelt, kann die Synthese über das Darstellungsverfahren C erfolgen (vgl. Reaktionsschema 3).

Reaktionsschema 3



- In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (I-2), (I-3), (V), (VI-1), (VI-2) und (VI-3) im Reaktionsschema 3 haben die chemischen Gruppierungen A_1 , A_2 , A_3 und A_4 sowie die Reste Z_1 , Z_3 ,
- 25 und Q die weiter oben beschriebenen Bedeutungen. In den Verbindungen mit der allgemeinen Formel (I-3) steht der Rest Z_{2a} für einen gegebenenfalls substituierten Aryl- oder Heteroarylrest, für einen gegebenenfalls substituierten Alkyl-, Alkenyl- oder Akynylrest, bevorzugt für einen Perfluoralkylrest. In den Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-3) steht X für eine geeignete

Abgangsgruppe. In den Verbindungen der allgemeinen Formel (I-2), (VI-2) und (VI-3) steht Hal steht für ein Halogen aus der Reihe Chlor, Brom oder Iod.

Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I-3) können aus Verbindungen der allgemeinen Formel (I-2), worin Hal für Iod steht, dargestellt werden. In den Verbindungen der
5 allgemeinen Formel (I-2) lässt sich das Iodatome metallvermittelt beispielsweise durch einen Perfluoralkylrest [WO 2005/095351], Aryl [J. Org. Chem. **2007**, 72(9), 3589-3591; Synthesis **1997**, (5), 563-566; Heterocycles **2006**, 68(11), 2247-2252] oder Alkenylrest [WO 2005/060749; Org. Proc. Res. & Dev. **2005**, 9(5), 694-696; Chem. & Pharm. Bull. **2005**, 53(2), 153-163; J. Org. Chem. **1986**, 51(26), 5286-90] ersetzen.

10 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I-2) können durch Umsetzung von aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (VI-3) mit (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (V) dargestellt werden. Die Reaktionsbedingungen für diese Umsetzung sind bereits im Darstellungsverfahren A bei der Synthese von Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1) beschrieben worden.

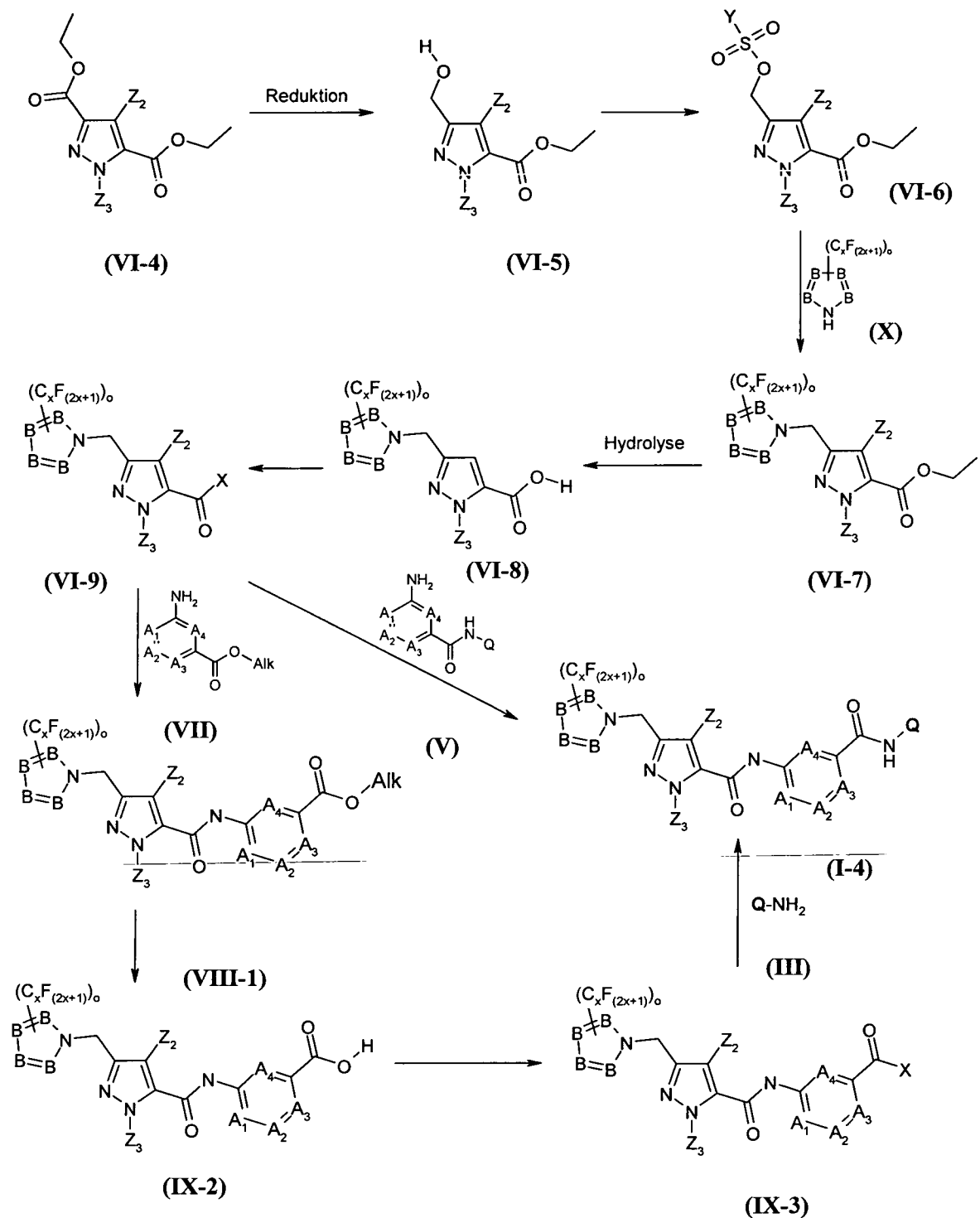
15 Die Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-3) können in einem zweistufigen Reaktionsverfahren ausgehend von Pyrazol-5-carbonsäuren des Typs (VI-1), die nach literaturbekannten Methoden hergestellt werden können [J. Org. Chem. **2008**, 73(9), 3523-3529; Bioorg. & Med. Chem. Letters **2005**, 15(22), 4898-4906; US-Pat. 2006/069270], erhalten werden. Dabei werden im ersten Reaktionsschritt die Pyrazole der allgemeinen Formel (VI-1) nach
20 literaturbekannten Methoden in der 4-Position halogeniert [Chlorierung: Bioorg. Med. Chem. Lett. **2007**, 17, 5620-5623; Bromierung: Chem. Ber. **1976**, 109, 268-273; Iodierung: Tetrahedron Lett. **2001**, 42, 863-865]. Die Hydroxyfunktion der Pyrazol-5-carbonsäure von (VI-2) wird anschließend nach denen bereits im Darstellungsverfahren A zur Herstellung von (VI) beschriebenen Methoden in die Abgangsgruppe X überführt.

25 Im Reaktionschema 4 ist das allgemeine Darstellungsverfahren D für die Darstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I-4) abgebildet. Die Synthese von Verbindungen der allgemeinen Formel (I-4) kann dabei nach zwei verschiedenen Reaktionswegen ausgehend von Intermediaten der allgemeinen Formel (VI-9) erfolgen. Zum Einen können diese Intermediate (VI-9) durch Kupplung mit (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der
30 allgemeinen Formel (V) zu (I-4) umgesetzt werden. Zum Anderen können die Intermediate (VI-9) auch mit (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (VII) gekuppelt werden. Bei beiden Kupplungsreaktionen können die im Darstellungsverfahren A genannten Verfahren zur Darstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1) aus (V) und (VI) verwendet werden. Anschließend wird der jeweilige Carbonsäureester von Verbindungen der
35 allgemeinen Formel (VIII-1) unter literaturbekannten Bedingungen gespalten [Greene's protective

groups in organic synthesis, 4. Edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey]. Die Hydroxyfunktionen der so erhaltenen Carbonsäuren der allgemeinen Formel (IX-2) werden anschließend analog zu denen im Darstellungsverfahren A beschriebenen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (VI) beschriebenen Methoden aktiviert und die so erhaltenen aktivierten Carbonsäurederivate der allgemeinen Formel (IX-3) mit (hetero)aromatischen Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (III) zu den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I-5) gekuppelt. Bei der Kupplungsreaktion können die im Darstellungsverfahren A genannten Verfahren zur Darstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I-1) aus (V) und (VI) verwendet werden. Die zentralen aktivierten Carbonsäurederivate der allgemeinen Formel (VI-9) sind aus den entsprechenden Carbonsäuren der allgemeinen Formel (VI-8) nach denen bei der Synthese von (VI) beschriebenen Methoden zugänglich. Die Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-8) sind aus dem entsprechenden Ethylester (VI-7) nach literaturbekannten Verfahren durch Esterspaltung zugänglich [Greene's protective groups in organic synthesis, 4. Edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey]. Die Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-7) können aus Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-6) mit substituierten 5-gliedrigen Heterozyklen der allgemeinen Formel (X) gebildet werden. Bevorzugt werden hierbei 5-gliedrige Heterozyklen verwendet, die mindestens einen halogenierten Substituenten, beispielsweise einen perfluorierten Alkylrest enthalten.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-6) können durch Sulfonylierung von Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-5) mit geeigneten Sulfonierungsreagenzien wie z.B. ~~Methansulfonsäure- oder Toluolsulfonsäurechlorid~~ dargestellt werden. Beide Reaktionen können gemäß einem literaturbekannten Verfahren durchgeführt werden [Tetrahedron Asym. 2006, 17, 2149-2153]. Die Hydroxymethylverbindungen der allgemeinen Formel (VI-5) können analog zu einem bekannten Literaturverfahren durch selektive Reduktion aus Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-4) dargestellt werden [J. Med. Chem. 2007, 50, 6291-6294]. Verbindungen der allgemeinen Formel (VI-4) lassen nach literaturbekannten Verfahren darstellen [J. Fluorine Chem. 1993, 61, 17-21].

Reaktionschema 4



In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (I-4), (III), (V), (VI-4), (VI-5), (VI-6), (VI-7), (VI-8), (VI-9), (VII), (VIII-1), (IX-2), (IX-3) und (X) im Reaktionsschema 4 haben die chemische Gruppierungen A_1 , A_2 , A_3 und A_4 sowie die Reste Z_2 , Z_3 , und Q die weiter oben beschriebenen Bedeutungen. In den Verbindungen der Formel (IX-3) und (VI-9) steht X für eine geeignete Abgangsgruppe und „Alk“ für einen Alkylrest, wie z.B. Methyl oder Ethyl. In den Verbindungen

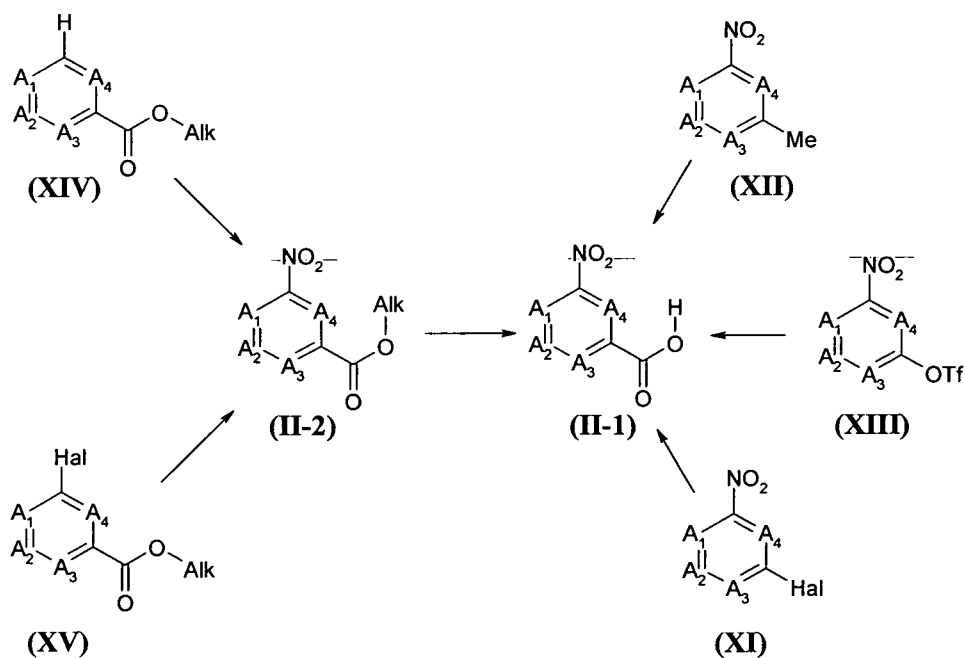
der Formel (VI-6) steht Y für einen Alkyl- bzw. (Het)Arylrest wie z.B. Methyl oder *para*-Tolyl. In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (I-4), (VI-7), (VI-8), (VI-9), (VIII-1), (IX-2), (IX-3) und (X) steht die chemische Gruppierung B unabhängig voneinander für ein gegebenenfalls substituiertes Kohlenstoffatom oder für ein Stickstoffatom, wobei der *N*-Heterozyklus bis zu vier

5 Stickstoffatome enthalten. Bevorzugte Substituenten für das Kohlenstoffatom sind fluoriierte Alkylreste der Formel $-\text{[C}_x\text{F}_{(2x+1)}\text{]}_o$, in denen der Wert *x* für die Zahlen 1-3 und der Wert *o* für die Zahlen 1-2 stehen kann.

Aktiviert Carbonsäurederivate der allgemeinen Formel (II) sind aus (hetero)aromatischen Carbonsäuren der allgemeinen Formel (II-1) nach bereits im Darstellungsverfahren A

10 beschriebenen Methoden zur Darstellung von (VI) zugänglich. Substanzen der allgemeinen Formel (II-1) sind allgemein bekannte Verbindungen der organischen Chemie, die nach ebenfalls bekannten Syntheseverfahren erhalten werden können. Mögliche Synthesewege der (hetero)aromatischen Aminocarbonsäuren der allgemeinen Formel (II-1) sind im Reaktionsschema 5 abgebildet.

15 Reaktionsschema 5



In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (II-1), (II-2), (XI), (XII), (XIII), (XIV) und (XV) im Reaktionsschema 5 haben die chemische Gruppierungen A₁, A₂, A₃ und A₄ die oben

20 beschriebenen Bedeutungen. Beispielsweise steht in den Verbindungen mit den allgemeinen Formeln (II-2), (XIV) und (XV) „Alk“ für einen Alkylrest, wie z. B. Methyl oder Ethyl und in den Verbindungen der allgemeinen Formel (XI) „Hal“ für ein Halogenatom aus der Reihe Fluor, Chlor, Brom und Iod.

Als Edukte zur Darstellung von Aminocarbonsäuren der allgemeinen Formel **(II-1)** können z.B. halogenierte (hetero)aromatische Nitroverbindungen der Formel **(XI)** eingesetzt werden. In den Verbindungen der Formel **(XI)** kann das Halogenatom durch eine Cyanogruppe ersetzt und diese anschließend unter saueren oder basischen Reaktionsbedingungen hydrolysiert werden. Der Halogen-Cyan-Austausch kann z.B. durch eine nucleophile Substitution am (Hetero)aromaten mit geeigneten Metallcyaniden wie z.B. Natriumcyanid [US 4,766,219] oder auch durch eine Kupfervermittelte Reaktion [J. Antibiotics **1994**, 47(12), 1456-65] erfolgen.

Des Weiteren können (hetero)aromatische Aminocarbonsäuren der allgemeinen Formel **(II-1)** auch aus den entsprechenden Methylverbindungen des Typs **(XII)** durch Oxidation mit einem geeigneten Oxidationsmittel dargestellt werden (vgl. z. B. Oxidationsreagenzien in: Comprehensive Organic Transformations; R. C. Larock, Wiley-VCH, 1999; die auf den Seiten 1213-1215 zitierte Literatur; Methods for the Oxidation of Organic Compounds; A. H. Haines, Academic Press 1985; Kapitel 3.4, Seite 117; Houbel-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. VII/2b Ketone Teil II, Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1976, Seite 1287).

Als geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise saure Dichromate (vgl. Chromium Oxidations in Organic Chemistry; Cainelli, Cardillo, Springer Verlag: New York, 1984; Reagents for Organic Synthesis; Fieser, Vol. 1, Wiley: New York, 1967, S. 142-147, 1059-1064 und weitere Bände aus dieser Reihe), Chromtrioxid und diesen ähnliche Verbindungen [Tetrahedron Lett. **1995**, 36(25), 4369-72; Bioorg. Med. Chem. Lett. **2007**, 17(4), 1043-1046] oder Permanganate, wie Kaliumpermanganat, oder Periodate wie beispielsweise Natriumperiodat, bekannt. Die Oxidationsreagenzien können aber auch polymergebunden vorliegen (vgl. Review: McKillop, Young Synthesis 401-422 (1979)). Sowohl Chromsäuren als auch Permanganate wurden auf diese Weise als Oxidationsmittel verwendet. Ebenfalls sind zahlreiche Phasen-Transfer-Reaktionen mit Permanganaten, Chromsäuren (Tetrahedron Lett. 4167 (1977), Landini et al. 134 (1979)) und Rutheniumtetroxid (Morris, Kiely J. Org. Chem. 52, 1149 (1987)) bekannt. Selbst Ultraschall-induzierte Oxidationsreaktionen sind denkbar – so ist die Verwendung von Kaliumpermanganat erwähnt (Yamawaki et al. 379 (1983)). Ebenso können für solche Oxidationen auch enzymatische Verfahren verwendet werden [WO 95/02061].

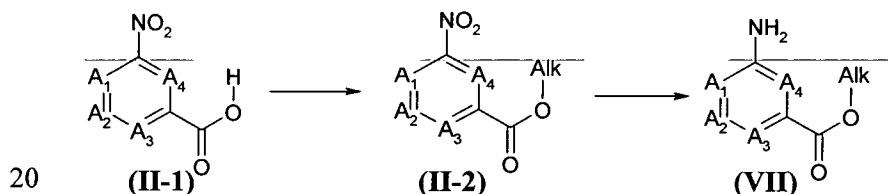
Die anschließend notwendige Reduktion der Nitrofunktion kann analog zu den weiter oben beschriebenen Verfahren durchgeführt werden.

Des Weiteren können (hetero)aromatische Aminocarbonsäuren der allgemeinen Formel **(II)** aus den entsprechenden (Hetero)aryl-Triflaten des Typs **(XIII)** mit Hilfe eines Palladium-katalysierten Verfahrens hergestellt werden [Synthesis **2006**, (4), 594-596].

Eine weitere Methode zur Darstellung von (hetero)aromatischen Aminocarbonsäuren der allgemeinen Formel (II-1) ist die literaturbekannte Spaltung von Carbonsäureestern der allgemeinen Formel (II-2) [Greene's protective groups in organic synthesis, 4. Edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey]. Diese Ester sind über
 5 verschiedene literaturbekannte Verfahren zugänglich und können beispielsweise aus den Verbindungen der allgemeinen Formeln (XIV) und (XV) durch Nitrierung dargestellt werden. Die Nitrierungen können beispielsweise analog zu literaturbekannten Verfahren durchgeführt werden [Justus Liebigs Ann. Chem. **1958**, 611, 194-205; Organikum, Wiley-VCH, 22. Auflage, 358ff; DE 3406997].

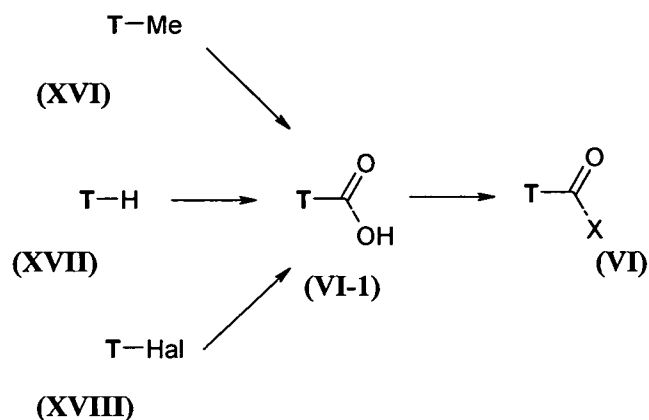
10 Die Synthese der (hetero)aromatischen Carbonsäurederivate der allgemeinen Formel (VII) sind im Reaktionsschema 6 abgebildet. Die Darstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (VII) kann durch die Reduktion der Nitrofunktion von Verbindungen der allgemeinen Formel (II-2) erfolgen. Die Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (II-2) ist bereits im weiter oben genannten Reaktionschema 5 beschrieben. Des Weiteren können diese Verbindungen auch
 15 durch Veresterung der Carbonsäurefunktion von Verbindungen der allgemeinen Formel (II-1) synthetisiert werden. Die Veresterungen können beispielsweise nach literaturbekannten Verfahren durchgeführt werden [Organikum, Wiley-VCH, 22. Auflage, 474ff; Bioorg. Med. Chem. Lett. **2007**, 17(22), 6305-6310].

Reaktionschema 6



In den allgemeinen Formeln der Verbindungen (II-1), (II-2) und (VII) im Reaktionsschema 6 haben die chemische Gruppierungen A₁, A₂, A₃ und A₄ die weiter oben beschriebenen Bedeutungen. In den allgemeinen Formeln (II-2) und (VII) steht „Alk“ für einen Alkylrest, wie z.B. Methyl oder Ethyl.

25 Die Synthese der (hetero)aromatischen Carbonsäurederivate der allgemeinen Formel (VI) ist im Reaktionsschema 7 abgebildet.

Reaktionsschema 7

In den Formeln der Verbindungen (VI-1), (VI), (XVI), (XVII) und (XVIII) im Reaktionsschema 7 hat der Rest T die weiter oben beschriebene Bedeutung. In der Formel (XVIII) steht Hal für ein Halogenatom aus der Reihe Fluor, Chlor, Brom und Iod. In der Formel (VI) steht X für eine geeignete Abgangsgruppe.

Die (hetero)aromatischen Carbonsäuren der allgemeinen Formel (VI-1) können unter anderem aus Methylderivaten der allgemeinen Formel (XVI), beispielsweise durch Oxidation der Methylgruppe dargestellt werden. Dabei können die bereits bei der Oxidation von Methylgruppen der Verbindungen der allgemeinen Formel (XII) genannten Verfahren angewendet werden.

Die (hetero)aromatischen Carbonsäuren der allgemeinen Struktur (VI-1) können ebenfalls aus geeigneten Verbindungen der allgemeinen Formel (XVII) durch Deprotonierung mit einer geeigneten Base und durch Abfangen des entsprechenden Carbanions mit Kohlendioxid dargestellt werden [J. Med. Chem. **2008**, 51(4), 937-947; Bioorg. Med. Chem. Lett. **2007**, 17(22), 6274-6279]. Als Base eignen sich z.B. Lithiumdiisopropylamid, n-Butyllithium, sec-Butyllithium und diesen ähnliche Verbindungen.

Für das oben beschriebene Verfahren zur Darstellung von (hetero)aromatischen Carbonsäuren der allgemeinen Formel (VI-1) eignen sich ebenfalls die entsprechenden halogenierten Heterozyklen der allgemeinen Formel (XVIII). Dabei wird das Carbanion allerdings nicht durch Deprotonierung generiert, sondern durch eine Metallierungsreaktion [Angew. Chem., Intern. Ed. **2008**, 47(2), 311-315]. Für diese Metallierungsreaktionen eignen sich vorzugsweise n-Butyllithium, tert-Butyllithium und iso-Propylmagnesiumchlorid.

Die (hetero)aromatischen Carbonsäuren der allgemeinen Formel (VII-1) können ebenfalls aus halogenierten Verbindungen der allgemeinen Formel (XVIII) mit Hilfe von literaturbekannten Palladium-katalysierten Reaktionen in die entsprechenden (hetero)aromatischen Carbonsäureester

überführt [Russ. J. Appl. Chem. 2007, 80(4), 571-575]. Diese (hetero)aromatischen Carbonsäureester können dann nach literaturbekannten Verfahren gespalten werden. [Greene's protective groups in organic synthesis, 4. Edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey]

- 5 Die (hetero)aromatischen Carbonsäuren der allgemeinen Formel (VII-1) können des Weiteren aus halogenierten Verbindungen der allgemeinen Formel (XVIII) durch eine Substitutionsreaktion der Halogene mit Cyaniden und anschließender Hydrolyse der Nitrilfunktion mit starken Säure oder Basen dargestellt werden [WO 2005/079801].

Als saure Reaktionshilfsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens können alle
10 Mineralsäuren (z.B. Halogenwasserstoff-säuren wie Fluorwasserstoffsäure, Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure oder Iodwasserstoffsäure sowie Schwefelsäure, Phosphorsäure, Phosphorige Säure, Salpetersäure) eingesetzt werden.

Bevorzugt werden Mineralsäuren wie Chlorwasserstoffsäure eingesetzt.

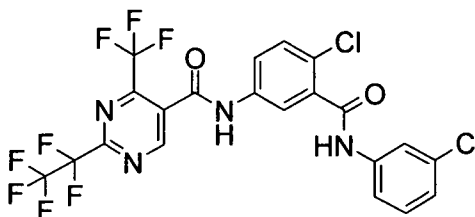
Die (hetero)aromatischen aktivierten Carbonsäurederivate, wie z.B. (hetero)aromatische
15 Carbonsäurehalogenide, wie sie durch die allgemeine Formel (VI) repräsentiert werden, können durch Umsetzung einer (hetero)aromatischen Carbonsäure der allgemeinen Formel (VI-1) mit geeigneten Halogenierungsreagenzien wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosphorylchlorid, Oxalylchlorid, Phosphortrichlorid, etc. hergestellt werden [Organikum, Wiley-VCH, 22. Auflage, 496ff].

20 Aktivierte (hetero)aromatische Carbonsäurederivate der allgemeinen Formel (II) können nach allgemein bekannten Methoden aus (hetero)aromatischen Carbonsäuren der Formel (II-1) dargestellt werden [Organikum, Wiley-VCH, 22. Auflage, 496ff; Chem. Ber. 1970, 788; J. Am. Chem. Soc 1967, 5012]. Die Verbindungen der Formel (II-1) sind kommerziell erhältlich oder können nach bekannten Literaturverfahren hergestellt werden [Synthesis 2006, (4), 594-596;
25 Tetrahedron Lett. 1995, 36(25), 4369-72; Bioorg. Med. Chem. Lett. 2007, 17(4), 1043-1046; WO 95/02061, J. Org. Chem. 1954, 19, 357-64; WO 2001/083459].

Verbindungen der allgemeinen Formel (III) sind kommerziell erhältlich und/oder können nach allgemein in der Fachliteratur bekannten Verfahren hergestellt werden [Houben-Weyl (1992), Vol. E, 16d, 646ff; Tetrahedron Lett., 33(24), 3487-90; 1992].

30 Verbindungen der allgemeinen Formel (VI) sind im Allgemeinen ebenfalls kommerziell erhältlich und/oder können nach bekannten Literaturverfahren dargestellt werden [Journal of Medicinal Chemistry 2008, 51(4), 937-947; Bioorg. Med. Chem. Lett. 2007, 17(22), 6274-6279; Russ. J. Appl. Chem. 2007, 80(4), 571-575; WO 2005079801; J. Org. Chem. 2008, 73(9), 3523-3529;

Bioorg. Med. Chem. Lett. **2005**, 15(22), 4898-4906; US-Pat. 2006/069270; J. Fluorine Chem. **1993**, 61, 17-21].

Experimenteller Teil**Darstellungsverfahren A****Beispiel Ia-32: N-{4-Chlor-3-[(3-chlorphenyl)carbamoyl]phenyl}-2-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxamid**

5

In 50 mL Dichlormethan werden 2,1 g (6,77 mM) 2-(Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carbonsäure mit 2 Tropfen DMF versetzt und auf 0 °C gekühlt. Nach tropfenweiser Zugabe von 0,71 mL (8,13 mM) Oxalsaeuredichlorid wird das Reaktionsgemisch 3h bei Raumtemperatur gerührt und anschließend eingengt. Man erhält das Rohprodukt 2-(Pentafluorethyl)-4-

10

(trifluormethyl)pyrimidin-5-carbonylchlorid.

In 2 mL absolutem Essigsäureethylester werden 84,3 mg (0,3 mM) 5-Amino-2-chlor-N-(3-chlorphenyl)benzamid, 3,05 mg (25 µM) *N,N*-Dimethylpyridin-4-amin (DMPA) gelöst. Die Lösung wird mit einem Eisbad auf 0 °C gekühlt und mit 96,9 mg (0,75 mM) *N*-Ethyl-diisopropylamin versetzt. 88,1 mg (0,25 mM) 2-(Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-

15

carbonylchlorid (wird als Rohprodukt eingesetzt) werden in 2 mL absolutem Essigsäureethylester gelöst bzw. suspendiert und dann zu der gekühlten Reaktionslösung hinzugegeben. Das Reaktionsgemisch wird 6 Stunden in einem Ölbad (Badtemperatur 50 °C) erhitzt und anschließend 16 Stunden bei Raumtemperatur weitergerührt. Die Reaktionslösung wird mit 8 mL Essigsäureethylester verdünnt. Die organische Phase wird zweimal mit 1 N Salzsäure, einmal mit 1

20

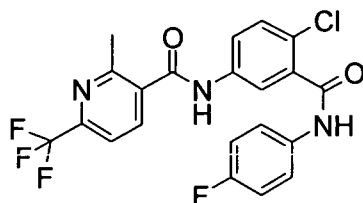
N Natronlauge und einmal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und Lösungsmittel am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck entfernt. Nach säulenchromatographischer Reinigung erhält man 82 mg (57%) *N*-{4-Chlor-3-[(3-chlorphenyl)carbamoyl]phenyl}-2-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxamid als weißen Feststoff.

25

¹H-NMR (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 11,02 (bs, 1H), 10,59 (bs, 1H), 9,71 (s, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,74 (dd, 1H), 7,61-7,58 (m, 2H), 7,38 (t, 1H), 7,18-7,15 (m, 1H) ppm.

HPLC-MS^a): logP = 4,32 Masse (m/z) = 573 [M+H]⁺.

Beispiel Ia-3: *N*-{4-Chlor-3-[(4-fluorphenyl)carbamoyl]phenyl}-2-methyl-6-(trifluormethyl)nicotinamid



In 4,8 mL Dichlormethan werden 246 mg (1,2 mM) 2-Methyl-6-(trifluormethyl)nicotinsäure mit 2
5 Tropfen DMF versetzt und auf 0 °C gekühlt. Nach tropfenweiser Zugabe von 0,13 mL (1,44 mM) Oxalsaeuredichlorid wird das Reaktionsgemisch 3h bei Raumtemperatur gerührt und anschließend eingengt. Man erhält das Rohprodukt 2-Methyl-6-(trifluormethyl)nicotinoylchlorid.

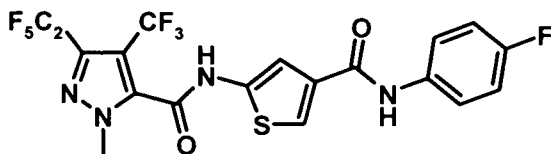
In 2 mL absolutem Essigsäureethylester werden 95,3 mg (0,36 mM) 5-Amino-2-chlor-*N*-(4-fluorphenyl)benzamid, 18,3 mg (0,15 mM) *N,N*-Dimethylpyridin-4-amin gelöst. Die Lösung wird
10 mit einem Eisbad auf 0 °C gekühlt und mit 0,16ml (0,90 mM) *N*-Ethyl-diisopropylamin versetzt. 67 mg (0,30 mM) 2-Methyl-6-(trifluormethyl)nicotinoylchlorid (wird als Rohprodukt eingesetzt) werden in 2 mL absolutem Essigsäureethylester gelöst bzw. suspendiert und dann zu der gekühlten Reaktionslösung hinzugegeben. Das Reaktionsgemisch wird 6 Stunden in einem Ölbad (Badtemperatur 50 °C) erhitzt und anschließend 16 Stunden bei Raumtemperatur weitergerührt.
15 Die Reaktionslösung wird mit 8 mL Essigsäureethylester verdünnt. Die organische Phase wird zweimal mit 1 N Salzsäure, einmal mit 1 N Natronlauge und einmal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und Lösungsmittel am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck entfernt.

Man erhält 135 mg (97%) *N*-{4-Chlor-3-[(4-fluorphenyl)carbamoyl]phenyl}-2-methyl-6-
20 (trifluormethyl)nicotinamid als weißen Feststoff.

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 10,69 (bs, 1H), 10,41 (bs, 1H), 8,16 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,79 (dd, 1H), 7,73-7,70 (m, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,19-7,14 (m, 2H), 2,65(s, 3H) ppm

HPLC-MS ^{a)}: logP = 3,15 Masse (m/z) = 452 [M+H]⁺.

25 **Beispiel If-2:** *N*-{4-[(4-Fluorphenyl)carbamoyl]-2-thienyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid

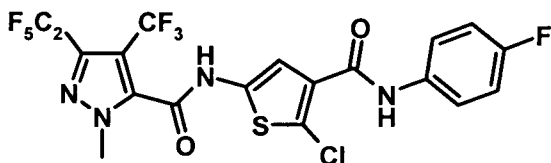


Zu einer Lösung aus 0,37 g (1,2 mmol) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure und 0,28 g (1,2 mmol) 5-Amino-N-(4-fluorphenyl)thiophen-3-carboxamid in 4 ml Tetrahydrofuran wird 0,36 g (1,2 mmol) 4-(4,6-Dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)-4-methylmorpholiniumchlorid gegeben und über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Es wird im Vakuum eingeengt, mit Wasser versetzt, mit Ethylacetat, mit Kochsalzlösung gewaschen und über Magnesiumsulfat getrocknet. Nach Einengen unter vermindertem Druck am Rotationsverdampfer und Reinigung des Rückstandes per Flashchromatographie (Cyclohexan/Ethylacetat) erhält man 100 mg (15%) *N*-{4-[(4-Fluorphenyl)carbamoyl]-2-thienyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxamid.

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 12,57 (s, 1H), 10,14 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,72-7,77 (m, 2H), 7,32 (s, 1H), 7,18 (m, 2H), 4,03 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS^a): logP = 3,80 Masse (m/z) = 531 [M+H]⁺.

15 **Beispiel If-2: *N*-{5-Chlor-4-[(4-fluorphenyl)carbamoyl]-2-thienyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxamid**

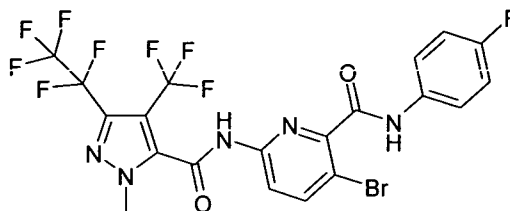


Zu einer Lösung von 70 mg (0,13 mmol) *N*-{4-[(4-Fluorphenyl)carbamoyl]-2-thienyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxamid in 0,6 ml Chloroform und 0,6 ml Eisessig werden 18 mg (0,13 mmol) *N*-Chlorsuccinimid gegeben. Es wird 10 Minuten gerührt, 0,16 ml *N,N*-Dimethylformamid zugegeben, und über Nacht bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wird mit Wasser versetzt, mit Ethylacetat extrahiert und die vereinigten organischen Extrakte mit ges. wäßr. Natriumhydrogencarbonatlösung und Wasser gewaschen. Man trocknet über Magnesiumsulfat und engt unter vermindertem Druck am Rotationsverdampfer ein. Man reinigt das Rohprodukt per präparativer HPLC (Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 μm, 50 x 4,6 mm; Acetonitril, Wasser, 2,75 ml/min) und isoliert 24 mg (32%) *N*-{5-Chlor-4-[(4-

fluorphenyl)carbamoyl]-2-thienyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid.

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 12,94 (s, 1H), 10,38 (s, 1H), 7,73 (m, 2H), 7,20 (t, 2H), 7,03 (s, 1H), 4,03 (s, 3H) ppm.

5 HPLC-MS^{a)}: logP = 4,35 Masse (m/z) – 565 [M+H]⁺.

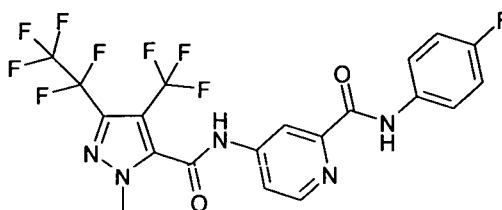
Darstellungsverfahren B**Beispiel Ic-1: N-[3-Brom-2-(4-fluor-phenylcarbamoyl)pyrid-6-yl]-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäureamid**

- 5 100 mg (0,196 mM) 3-Brom-6-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure werden in 9 mL Dichlormethan abs. gelöst/suspendiert und anschließend nacheinander mit 21,7 mg (0,196 mM) 4-Fluor-anilin, 96,6 mg (0,254 mM) 2-(7-Aza-1H-benzotriazole-1-yl)-1,1,3,3-tetramethyluronium hexafluorophosphat (HATU) und 97 μ L (0,587 mM) N-Ethyl-diisopropylamin versetzt. Das Reaktionsgemisch wird 30 Stunden bei
- 10 Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wird der Reaktionsansatz nacheinander mit 1N Salzsäure und Natriumhydrogen-carbonat-Lösung gewaschen. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeeengt. Der verbleibende Rückstand wird zunächst mittels Säulenchromatographie an Kieselgel und anschließend mittels präparativer HPLC gereinigt.
- 15 Man erhält 51,2 mg (43%) N-[3-Brom-2-(4-fluor-phenylcarbamoyl)pyrid-6-yl]-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäureamid.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 12,0 (s, 1H), 10,5 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,15 (br, 1H), 7,68 (dd, 2H), 7,17 (dd, 2H), 3,98 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 4,45, Masse $[\text{M}+\text{H}]^+$ = 604.

Beispiel Ib-1: *N*-[2-(4-fluor-phenylcarbamoyl)pyrid-4-yl]-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carbonsäureamid



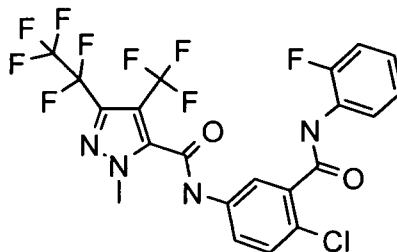
150 mg (0,347 mM) 4-([1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl)-amino)pyridin-2-carbonsäure werden in 13,5 mL Dichlormethan abs. gelöst/suspendiert und anschließend nacheinander mit 38,6 mg (0,347 mM) 4-Fluor-anilin, 171,4 mg (0,451 mM) 2-(7-Aza-1*H*-benzotriazole-1-yl)-1,1,3,3-tetramethyluronium hexafluorophosphat und 172 μ L (0,587 mM) *N*-Ethyl-diisopropylamin versetzt. Das Reaktionsgemisch wird 30 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wird der Reaktionsansatz nacheinander mit 1N Salzsäure und Natriumhydrogencarbonat-Lösung gewaschen. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeeengt. Der verbleibende Rückstand wird zunächst mittels Säulenchromatographie an Kieselgel und anschließend mittels präparativer HPLC gereinigt.

Man erhält 94,9 mg (52%) *N*-[2-(4-fluor-phenylcarbamoyl)pyrid-4-yl]-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carbonsäureamid.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ = 9,88 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,08 (d, 2H), 7,05 (d, 2H), 1,61 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 4,30, Masse $[\text{M}+\text{H}]^+ = 526$.

Beispiel Ia-18: *N*-{4-Chlor-3-[(2-fluorphenyl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid



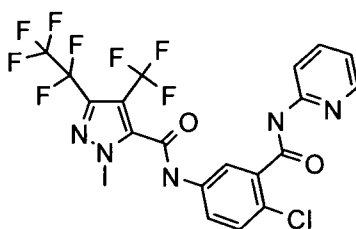
70 mg (0,15 mmol) 2-Chlor-5-([1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl)-amino)benzolcarbonsäure werden in 2mL Dichlormethan gelöst / suspendiert. Dann werden 25 mg (0,15 mmol) 6-Chloro-hydroxybenzotriazol, 37 mg (0,195mmol) *N*-(3-

Dimethylaminopropyl)-N'-ethyl-carbodiimid-hydrochlorid und 52,3 μL (0,3mmol) *N*-Ethyl-diisopropylamin dazugegeben und die Mischung 20 Minuten bei RT gerührt. Anschliessend werden 21 mg (0,195mmol) 2-Fluoroanilin dazugegeben und die Mischung bei Raumtemperatur über Nacht gerührt. Nach dieser Zeit wurde die Reaktionsmischung eingeeengt und das erhaltene Rohprodukt über präparative HPLC gereinigt. Man erhält 39 mg (46%) *N*-{4-Chlor-3-[(2-fluorphenyl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid als weißen Feststoff.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,20 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,60 (d, 1H), 7,25 (m, 3H), 4,02 (s, 3H) ppm.

10 HPLC-MS ^{b)}: logP = 3,94, Masse [M+H]⁺ = 559

Beispiel Ia-8: *N*-[4-Chlor-3-(pyrid-2-yl-carbamoyl)phenyl]-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid

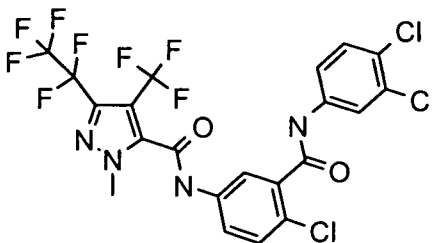


70 mg (0,15mmol) 2-Chlor-5-([1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl)-amino)benzolcarbonsäure werden in 2mL Dichlormethan gelöst / suspendiert. Dann werden 25 mg (0,15mmol) 6-Chloro-hydroxybenzotriazol, 37 mg (0,195mmol) *N*-(3-Dimethylaminopropyl)-*N'*-ethyl-carbodiimid-hydrochlorid und 52,3 μL (0,3mmol) *N*-Ethyl-diisopropylamin dazugegeben und die Mischung 20 Minuten bei RT gerührt. Anschliessend werden 18 mg (0,195mmol) 2-Aminopyridin dazugegeben und die Mischung bei Raumtemperatur über Nacht gerührt. Nach dieser Zeit wurde die Reaktionsmischung eingeeengt und das erhaltene Rohprodukt über präparative HPLC gereinigt. Man erhält 46 mg (57%) *N*-[4-Chlor-3-(pyrid-2-yl-carbamoyl)phenyl]-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid als weißen Feststoff.

25 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,80 (s, 1H), 8,35 (dd, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,85 (m, 2H), 7,73 (dd, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,15 (dd, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{b)}: logP = 3,53, Masse [M+H]⁺ = 542

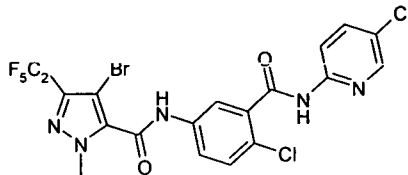
Beispiel Ia-42: *N*-{4-Chlor-3-[(3,4-dichlorphenyl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid



70 mg (0,15mmol) 2-Chlor-5-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)benzolcarbonsäure werden in 2mL Dichlormethan gelöst / suspendiert. Dann werden 25 mg (0,15mmol) 6-Chloro-hydroxybenzotriazol, 37 mg (0,195mmol) *N*-(3-Dimethylaminopropyl)-*N'*-ethyl-carbodiimid-hydrochlorid und 52.3 μ L (0,3mmol) *N*-Ethyl-diisopropylamin dazugegeben und die Mischung 20 Minuten bei RT gerührt. Anschliessend werden 32 mg (0,195mmol) 3,4-Dichloranilin dazugegeben und die Mischung bei Raumtemperatur über Nacht gerührt. Nach dieser Zeit wurde die Reaktionsmischung eingeengt und das erhaltene Rohprodukt über präparative HPLC gereinigt. Man erhält 20 mg (21%) *N*-{4-Chlor-3-[(3,4-dichlorphenyl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamid als weißen Feststoff.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,70 (s, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (m, 3H), 4,02 (s, 3H) ppm.

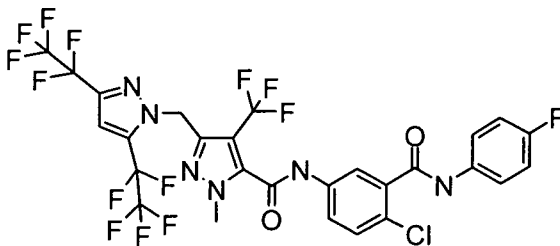
HPLC-MS^b): logP = 4,65, Masse [M+H]⁺ = 611

Darstellungsverfahren C**Beispiel Ia-35: 4-Bromo-N-{4-chloro-3-[(4-chloropyridin-2-yl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-3-(pentafluoroethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamid**

- 5 Zu einer Lösung von 0,1 g (0,21 mmol) 5-({[4-Bromo-1-methyl-3-(pentafluoroethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-2-chlorobenzoesäure und 48,3 mg (0,25 mmol) 1-Ethyl-3-[3-dimethylaminopropyl]carbodiimid Hydrochlorid in 20 mL Dioxan werden 27 mg (0,21 mmol) 5-Chloropyridin-2-amin gelöst in 0,5 mL Dioxan getropft und das Reaktionsgemisch 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Dioxan wird zum Großteil bei vermindertem Druck am
- 10 Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand mit 10 mL Wasser versetzt. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert und die organische Phase anschließend dreimal mit gesättigter Kochsalzlösung gewaschen. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer bei vermindertem Druck abdestilliert und der Rückstand mittels
- 15 Flashchromatographie an Kieselgel gereinigt. Man erhält 11mg (8%) 4-Bromo-N-{4-chloro-3-[(4-chloropyridin-2-yl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-3-(pentafluoroethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide als Öl.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril): δ = 4,08 (s, 3H), 7,21 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,80 (m, 1H), 7,93 (m, 1H), 8,24 (m, 1H), 8,34 (s, 1H), 9,01 (br, s, 1H), 9,29 (br, s, 1H) ppm.

HPLC-MS^a): logP = 4,38, Masse (m/z) = 588 [M+H]⁺.

20 Herstellungsverfahren D**Beispiel Ia-43: 3-{[3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl}-N-{4-chlor-3-[(4-fluorphenyl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxamid**

1,83 g (3,59 mM) 3-{{[3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl}}-1-methyl-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure in 10 mL Dichlormethan werden mit 0,9 g Oxalsäuredichlorid (7,17 mM) und 26 mg *N,N*-Dimethylformamid (0,36 mM) versetzt und 3 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Es wird im Vakuum eingeengt und man erhält 1,8 g 3-{{[3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl}}-1-methyl-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonylchlorid (3,40 mM, 90% der Theorie), das ohne weitere Aufreinigung im nächsten Schritt umgesetzt wird.

Zu 0,28 g 5-Amino-2-chlor-*N*-(4-fluorphenyl)benzamid (1,04 mM) und 0,11 g 4-Methylmorpholin (1,04 mM) in 15 mL Dichlormethan wird bei -10°C 0,5 g 3-{{[3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl}}-1-methyl-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonylchlorid (0,95 mM) in 5 mL Dichlormethan zugetropft. Es wird auf Raumtemperatur erwärmt und 1 Stunden nachgerührt. Nach Zugabe von 10 mL Wasser wird mit gesättigter wässriger Natriumhydrogencarbonat-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeengt. Nach säulenchromatographischer Aufreinigung erhält man 0,17 g 3-{{[3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl]methyl}}-*N*-{4-chlor-3-[(4-fluorphenyl)carbamoyl]phenyl}-1-methyl-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxamid (24%).

¹H-NMR (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 11,13 (s, 1H), 10,42 (s, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,70-7,76 (m, 3H), 7,56 (d, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,16 (m, 2H), 5,72 (s, 2H), 3,85 (s, 3H) ppm.

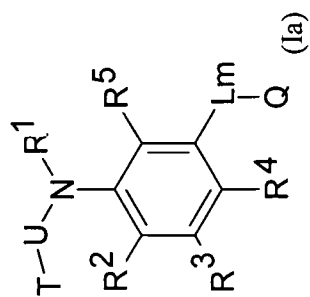
HPLC-MS^{a)}: logP = 4,99, Masse (m/z) = 757 [M+H]⁺.

~~a) Anmerkung zur Bestimmung der logP-Werte und Massendetektion: Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Direktive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C18). Agilent 1100 LC-System; 50*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluent A: Acetonitril (0,1 % Ameisensäure); Eluent B: Wasser (0,09 % Ameisensäure); linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril in 4,25 min, dann 95% Acetonitril für weitere 1,25 min; Ofentemperatur 55 °C; Fluß: 2,0 mL/min. Die Massendetektion erfolgt über ein Agilent MSD-System.~~

b) Anmerkung zur Bestimmung der logP-Werte und Massendetektion: Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Direktive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C18). HP1100; 50*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluent A: Acetonitril (0,1 % Ameisensäure); Eluent B: Wasser (0,08 % Ameisensäure); linearer Gradient von 5 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril in 1,70 min, dann 95 % Acetonitril für weitere 1,00 min; Ofentemperatur 55°C; Fluß: 2,0 mL/min. Die Massendetektion erfolgt über den Massendetektor Micromass ZQ2000 der Firma Waters.

Mit Hilfe der oben beschriebenen Darstellungsverfahren A bis D wurden die in den **Tabellen 1 - 6** aufgeführten Verbindungen dargestellt.

Tabelle 1



Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-1	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	-CO-	H	H	H	Cl	H	-CONH-	1	Pyridin-4-yl	1,99 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,80 (s, 1H), 8,48 (dd, 2H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,65 (dd, 2H), 7,60 (d, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-2	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	-CO-	H	H	H	Cl	H	-CONH-	1	Pyridin-3-yl	2,69 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,70 (s, 1H), 8,83 (s, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,40 (dd, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-4	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	-CO-	H	H	H	Cl	H	-CONH-	1	4-Chlorpyridin-3-yl	3,33 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,75 (s, 1H), 8,90 (d, 1H), 8,68 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (d, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-5	2-(Trifluormethyl)-1,3-thiazol-4-yl	-CO-	H	H	H	Cl	H	-CONH-	1	4-Fluorphenyl	3,35 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,52 (bs, 1H), 10,40 (bs, 1H), 8,84 (s, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,97 (dd, 1H), 7,73 (m, 2H), 7,53 (d, 1H), 7,20-7,14 (m, 2H) ppm	A

Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-6	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	CONH-	1	2-Chlorpyridin-4-yl	3,37 ^{b)}	-	B
Ia-7	4-Brom-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	CONH-	1	6-Chlorpyridin-3-yl	3,42 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,16 (s, 1H), 10,98 (s, 1H), 8,72 (d, 1H), 8,20 (dd, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,78 (dd, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 4,04 (s, 3H) ppm,	B
Ia-9	2-Methyl-6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	CONH-	1	3-Chlorphenyl	3,6 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,70 (bs, 1H), 10,56 (bs, 1H), 8,16 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,84 (d, 1H), 7,80 (dd, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,37 (t, 1H), 7,18-7,15 (m, 1H), 2,65 (s, 3H) ppm	A
Ia-10	4-(Difluormethyl)-2-(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	CONH-	1	4-Fluorphenyl	3,67 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,99 (bs, 1H), 10,34 (bs, 1H), 9,57 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,78-7,70 (m, 3H), 7,58 (d, 1H), 7,34 (t, 1H), 7,18-7,11 (m, 2H) ppm	A
Ia-11	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	CONH-	1	6-Chlorpyridin-3-yl	3,68 ^{b)}	-	B
Ia-12	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	CONH-	1	4-Methoxyphenyl	3,68 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,20 (s, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,55 (m, 3H), 6,90 (d, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,73 (s, 3H) ppm	B

Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-13	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	2-Chlorpyridin-3-yl	3,73 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,40 (s, 1H), 10,30 (s, 1H), 8,30 (dd, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,50 (dd, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-14	2-(Trifluormethyl)-1,3-thiazol-4-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3-Chlorphenyl	3,82 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,55 (bs, 1H), 10,53 (bs, 1H), 8,84 (s, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,98 (dd, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,37 (t, 1H), 7,16 (m, 1H) ppm	A
Ia-15	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	Phenyl	3,84 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,40 (s, 1H), 10,30 (s, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,70 (d, 2H), 7,60 (d, 1H), 7,35 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-16	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3-Methoxyphenyl	3,84 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,40 (s, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,37 (s, 1H), 7,23 (d, 2H), 6,70 (m, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,75 (s, 3H) ppm	B
Ia-17	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	3,89 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,55 (d, 1H), 7,15 (t, 2H), 4,03 (s, 3H) ppm	B
Ia-19	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	6-Chlorpyridin-2-yl	3,94 ^{b)}	-	B

Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-20	2-(Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	H	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	3,98 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,0 (bs, 1H), 10,44 (bs, 1H), 9,71 (s, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,74-7,70 (m, 3H), 7,59 (d, 1H), 7,19 - 7,14 (m, 2H) ppm	A
Ia-21	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	H	H	- CONH- -	1	3-Fluorphenyl	4,00 ^{b)}	-	B
Ia-22	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	H	H	- CONH- -	1	2,4-Difluorphenyl	4,05 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,20 (s, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,60 (d, 1H), 7,28 (ddd, 1H), 7,10 (ddd, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-23	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	H	H	- CONH- -	1	4-Fluor-2-methylphenyl	4,05 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,10 (dd, 1H), 7,02 (m, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,30 (s, 3H) ppm	B
Ia-24	4-Cyclopropyl-2-(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	H	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	4,08 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,93 (bs, 1H), 10,41 (bs, 1H), 9,06 (s, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,79 (dd, 1H), 7,73-7,69 (m, 2H), 7,56 (d, 1H), 7,17 (t, 2H), 2,5 (m, 1H), 1,29-1,25 (m, 2H), 1,20-1,17 (m, 2H) ppm	A
Ia-25	4-(Difluormethyl)-2-(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	H	H	- CONH- -	1	3-Chlorphenyl	4,08 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,0 (bs, 1H), 10,59 (bs, 1H), 9,58 (s, 1H), 7,88 (d, 2H), 7,74 (dd, 1H), 7,59 (d, 2H), 7,38 (t, 1H), 7,34 (t, 1H), 7,18 (dd, 1H) ppm	A

Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log P	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-26	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Chlorpyridin-2-yl	4,17 ^{b)}	-	B
Ia-27	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	5-Chlorpyridin-2-yl	4,17 ^{b)}	-	B
Ia-28	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Chlorphenyl	4,23 ^{b)}	-	B
Ia-29	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluor-3-methylphenyl	4,23 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,40 (s, 1H), 10,30 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,10 (t, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,22 (s, 3H) ppm	B
Ia-30	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3-Chlorphenyl	4,28 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,60 (s, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (m, 2H), 7,35 (dd, 1H), 7,15 (d, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-31	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	2-Chlorphenyl	4,28 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,40 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,40 (t, 1H), 7,25 (dd, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-33	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3-Chlor-4-fluor-2-methylphenyl	4,34 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,25 (t, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,35 (s, 3H) ppm	B

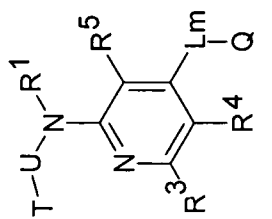
Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log P	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-34	2,4-Bis(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	4,36 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₁ -Acetonitril): δ = 9,39 (s, 1H), 9,07 (bs, 1H), 8,75 (bs, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,73 (dd, 1H), 7,67 (m, 2H), 7,53 (d, 1H), 7,15-7,11 (m, 2H) ppm	A
Ia-36	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-(Trifluormethyl)phenyl	4,40 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,80 (s, 1H), 7,90 (d, 2H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,70 (d, 2H), 7,60 (d, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-37	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3-(Trifluormethyl)phenyl	4,40 ^{b)}	-	B
Ia-38	4-Brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Chlorphenyl	4,43 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 4,04 (s, 3H), 7,34 (m, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,78 (m, 2H), 7,93 (m, 2H), 8,34 (m, 1H), 9,06 (bs, 1H), 9,15 (bs, 1H)	B
Ia-39	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl	4,51 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,40 (s, 1H), 10,80 (s, 1H), 8,15 (m, 1H), 7,95 (m, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,50 (m, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-40	4-Cyclopropyl-2-(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3-Chlorphenyl	4,54 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,95 (bs, 1H), 10,56 (bs, 1H), 9,06 (s, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,80 (dd, 1H), 7,59 (t, 2H), 7,37 (t, 1H), 7,17 (m, 1H), 2,5 (m, 1H), 1,29-1,25 (m, 2H), 1,20-1,16 (m, 2H) ppm	A

Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-41	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	2-Chlor-4-fluor-5-methylphenyl	4,64 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,30 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,23 (s, 3H) ppm	B
Ia-44	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	3,4,5-Trichlorphenyl	5,15 ^{b)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,40 (s, 1H), 10,80 (s, 1H), 7,95 (s, 2H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,60 (d, 1H), 4,02 (s, 3H) ppm	B
Ia-45	4-(Pyrid-2-yl)-2-(trifluormethyl)-pyrimidin-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	3,29 ^{a)}	¹ H-NMR (400 MHz, d ₇ -DMF): δ = 10,81 (s, 1H), 10,55 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 8,65-8,63 (m, 1H), 8,45-8,42 (m, 1H), 8,17-8,12 (m, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,90-7,87 (m, 2H), 7,82-7,79 (dd, 1H), 7,64-7,61 (m, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,27-7,22 (t, 2H) ppm	A
Ia-46	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	F	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	4,37	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,52 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,85 (dd, 1H), 7,62-7,69 (m, 2H), 7,56-7,58 (m, 1H), 7,10-7,16 (m, 2H), 3,98 (s, 3H) ppm.	B
Ia-47	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	F	SMe	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	4,29	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,31 (s, 1H), 8,73 (s, 1H), 7,61-7,71 (m, 3H), 7,51 (s, 1H), 7,08-7,14 (m, 2H), 3,98 (s, 3H), 2,43 (s, 3H) ppm.	B
Ia-48	1-Methyl-3,4-Bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH- -	1	4-Fluorphenyl	3,68	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,13 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,60-7,72 (m, 2H), 7,52 (d, 1H), 7,07-7,14 (m, 2H), 3,98 (s, 3H) ppm.	A

Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-49	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	Br	SMe	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,60	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,25 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,59-7,70 (m, 3H), 7,07-7,15 (m, 2H), 3,98 (s, 3H), 2,41 (s, 3H) ppm.	B
Ia-50	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	Cl	SMe	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,54	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,26 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,60-7,68 (m, 3H), 7,08-7,14 (m, 2H), 3,98 (s, 3H), 2,41 (s, 3H) ppm.	B
Ia-51	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	Cl	I	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,55	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,28 (s, 1H), 8,56 (s, 1H), 7,93-7,95 (m, 1H), 7,54-7,70 (m, 3H), 7,08-7,17 (m, 2H), 3,98 (s, 3H) ppm.	B
Ia-52	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	Br	Br	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,62	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,40 (s, 1H), 8,76 (s, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,61-7,66 (m, 2H), 7,11-7,17 (m, 2H), 3,99 (s, 3H) ppm.	B
Ia-53	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	Br	I	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,61	-	B
Ia-54	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	Cl	Br	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,58	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,40 (s, 1H), 8,76 (s, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,61-7,67 (m, 3H), 7,12-7,17 (m, 2H), 3,98 (s, 3H) ppm.	B

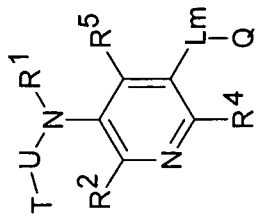
Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ia-55	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	F	I	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,33	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,49 (s, 1H), 8,75 (s, 1H), 7,65-7,72 (m, 3H), 7,47-7,48 (m, 1H), 7,12-7,18 (m, 2H), 3,98 (s, 3H) ppm.	B
Ia-56	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	F	Br	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,29	¹ H-NMR (400 MHz, d ₃ -Acetonitril): δ = 9,46 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 7,80 (dd, 1H), 7,63-7,68 (m, 2H), 7,52-7,53 (m, 1H), 7,12-7,17 (m, 2H), 3,99 (s, 3H) ppm.	B
Ia-57	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	M e	H	H	Cl	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,06	-	B
Ia-58	1-Ethyl-3,4-Bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	- CO -	H	H	H	Cl	H	- CONH-	1	4-Fluorphenyl	-	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃): δ = 8,89 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,81-7,86 (m, 2H), 7,66-7,67 (m, 1H), 7,14-7,47 (m, 4H), 4,33 (q, 2H), 1,51 (t, 3H) ppm.	B

Tabelle 4



Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Id-1	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	-CO-	H	H	Br	H	-CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,10		B
Id-2	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl	-CO-	H	H	Cl	H	-CONH-	1	4-Fluorphenyl	4,07		B

Tabelle 5

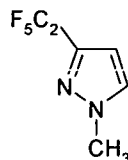


Bsp.-Nr.	T	U	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	L	m	Q	log p	¹ H-NMR	Herstellverfahren
Ie-1	1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1 <i>H</i> -pyrazol-5-yl	-CO-	H	H	Cl	H	-CONH-	1	4-Fluorphenyl	3,82		B

- a) Anmerkung zur Bestimmung der logP-Werte und Massendetektion: Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Direktive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C18). Agilent 1100 LC-System; 50*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluent A: Acetonitril (0,1 % Ameisensäure); Eluent B: Wasser (0,09 % Ameisensäure); linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril in 4,25 min, dann 95% Acetonitril für weitere 1,25 min; Ofentemperatur 55 °C; Fluß:2,0 mL/min. Die Massendetektion erfolgt über ein Agilent MSD-System.
- b) Anmerkung zur Bestimmung der logP-Werte und Massendetektion: Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Direktive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C18). HP1100; 50*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluent A: Acetonitril (0,1 % Ameisensäure); Eluent B: Wasser (0,08 % Ameisensäure); linearer Gradient von 5 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril in 1,70 min, dann 95 % Acetonitril für weitere 1,00 min; Ofentemperatur 55°C; Fluß:2,0 mL/min. Die Massendetektion erfolgt über den Massendetektor Micromass ZQ2000 der Firma Waters.

Herstellung der Ausgangsverbindungen

1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol

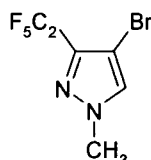


Zu einer Lösung von 30,9 g (141,7 mmol) (E)-5-Ethoxy-1,1,1,2,2-pentafluoropent-4-en-3-one
5 (Herstellung: Synthesis 2000, 5, 738-42) in 56 mL Methanol werden 7,18 g (155,8 mmol)
Methylhydrazin getropft und das Reaktionsgemisch 18 Stunden lang unter Rückfluß erhitzt. Das
Methanol wird zum Großteil bei Normaldruck abdestilliert abdestilliert und der Rückstand auf Eis
gegeben. Die wässrige Phase wird dreimal mit Dichlormethan extrahiert und die organische Phase
anschließend dreimal mit gesättigter Kochsalzlösung gewaschen. Nach Trocknen über
10 Natriumsulfat wird das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer bei vermindertem Druck
abdestilliert. Man erhält 15,81 g (52%) 1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol als Öl.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril) δ = 3,89 (s, 3H), 6,57 (m, 1H), 7,61(m, 1H) ppm;

HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,29; Masse (m/z): 201 (M+H)⁺.

4-Brom-1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol



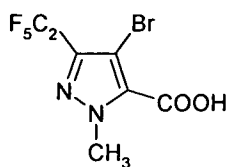
15

Zu einer Lösung von 4,2 g (20,9 mmol) 1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol in 18 mL Wasser
werden bei 40°C 3,27 g (20,5 mmol) Brom getropft und das Reaktionsgemisch zunächst 1Stunde
bei 60°C und dann 18 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Die wässrige Phase wird dreimal
mit Dichlormethan extrahiert und die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet. Das
20 Dichlormethan wird am Rotationsverdampfer bei vermindertem Druck abdestilliert. Man erhält
5,42 g (71%) 4-Brom-1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol als Öl.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril) δ = 3,90 (s, 3H), 7,77 (m, 1H) ppm;

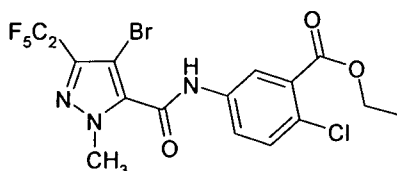
HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,99; Masse (m/z): 280 (M+H)⁺.

4-Brom-1-Methyl-3-pentafluoroethyl-1H-pyrazol-5-carbonsäure



Unter Argonatmosphäre werden 2,7 g (9,67 mmol) 4-Brom-1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazolin Diethylether vorgelegt und die Lösung auf -78°C gekühlt. Man tropft 5,32 mL (10,6 mmol) 2M Lithiumdiisopropylamidlösung in THF/Heptan zu und gibt bei -30°C unter starkem
 5 Rühren 250 g zerstoßenes Trockeneis zu. Nach Beendigung der Gasentwicklung versetzt man das Reaktionsgemisch mit 235 mL Wasser und stellt mit 1N Natronlauge pH 11 ein. Die alkalische Lösung wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert und daraufhin mit 1N Salzsäure auf pH 2 gestellt. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert und die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels am Rotationsverdampfer unter
 10 vermindertem Druck erhält man 1,0 g (32%) 4-Brom-1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol-5-carbonsäure als Feststoff.

Ethyl-5-({[4-brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-2-chlorbenzoat

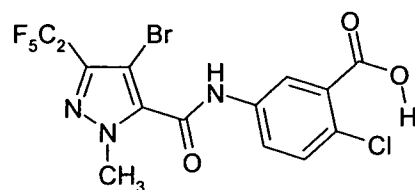


15 2,1 g (6,46 mmol) 4-Brom-1-Methyl-3-pentafluorethyl-1H-pyrazol-5-carbonsäure und 1,49 g (7,75 mmol) 1-Ethyl-3-[3-dimethylaminopropyl]carbodiimid Hydrochlorid werden in 30 mL Dioxan vorgelegt und nach 30 Minuten Rühren mit einer Lösung von 1,29 g (6,46 mmol) Ethyl-5-amino-2-chlorbenzolcarboxylat in 20 mL Dioxan versetzt. Nach 18 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wird das Dioxan am Rotationsverdampfer bei vermindertem Druck abdestilliert
 20 und das Reaktionsgemisch mit 50 mL Wasser versetzt. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert und die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck wird der Rückstand mittels Flashchromatographie an Kieselgel gereinigt. Man erhält 0,63 g (16%) Ethyl-5-({[4-brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-2-chlorbenzoat.

25 ¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril) δ = 1,36 (t, 3H), 4,10 (s, 3H), 4,40 (q, 2H), 7,52 (m, 1H), 7,60 (m, 1H), 8,10 (s, 1H), 8,87 (br, s, 1H) ppm;

HPLC-MS^{a)}: logP = 4,48; Masse (m/z): 505,8 (M+H)⁺.

5-({[4-Brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-2-chlorbenzoesäure



Zu einer Lösung von 0,55 g (1,1 mmol) Ethyl-5-({[4-brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-2-chlorbenzoat in 6 mL Ethanol wird eine Lösung von 0,105 g (4,36 mmol) Lithiumhydroxid in 1,5 mL Wasser getropft und die Lösung 18 Stunden bei

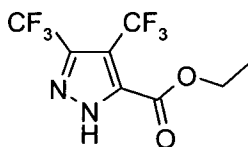
5 Raumtemperatur gerührt. Das Ethanol wird am Rotationsverdampfer bei vermindertem Druck abdestilliert und die Lösung mit halbkonzentrierter Salsäure auf pH 1 gestellt. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert und die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck erhält man 0,54 g (86%) 5-({[4-Brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-2-

10 chlorbenzoesäure.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril) $\delta = 4,06$ (s, 3H), 7,53 (m, 1H), 7,80 (m, 1H), 8,17 (s, 1H), 9,05 (br, s, 1H) ppm;

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 3,13$; Masse (m/z): 476 (M+H)⁺.

15 Ethyl-3,4-bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxylat



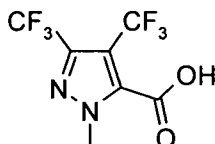
7,57 g (63,0 mmol) Diazoethylacetat werden unter Schutzgas in 200 mL Diethylether vorgelegt

20 und auf -70°C temperiert. Es werden anschließend 20,4 g (126 mmol) Hexafluorbutin in die gekühlte Lösung eingeleitet. Das Reaktionsgemisch wird langsam auf Raumtemperatur erwärmt und 16 Stunden gerührt. Anschließend wird das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer entfernt. Man erhält 17,0 g Ethyl-3,4-bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxylat (98%) als gelbes Öl.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril): $\delta = 4,42$ (q, 2H), 1,38 (t, 3H) ppm.

GC-MS: Retentionszeit 3,48 min; Masse (m/z) = 276 [M]⁺.

1-Methyl-3,4-bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure



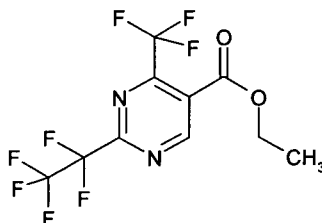
5

3,0 g (10,9 mmol) Ethyl-3,4-bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carboxylat und 4,5 g (32,6 mmol) Kaliumcarbonat werden in 70 mL Aceton suspendiert und mit 1,35 mL Iodmethan (21,7 mmol) versetzt. Das Reaktionsgemisch wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Zu der Suspension werden 54 mL (108 mmol) 2 N Natronlauge gegeben. Die Lösung wird anschließend über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wird mit Wasser verdünnt und das Aceton weitestgehend am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck entfernt. Der Rückstand wird mit 1 M Salzsäure auf pH 2-3 eingestellt. Die wässrige Reaktionslösung wird zweimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und unter vermindertem Druck am Rotationsverdampfer eingeeengt. Man erhält 2,7 g 1-Methyl-3,4-bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure (84%; Reinheit 88%) als braunen Feststoff.

¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 4,12 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS^{a)}: logP = 1,47; Masse (m/z) = 263 [M+H]⁺.

20 Ethyl-2-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxylat



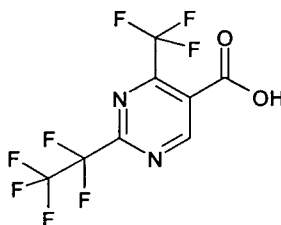
Eine Mischung von 8,1 g (50 mmol) 2,2,3,3,3-Pentafluorpropanimidamid und 12 g (50 mmol) Ethyl-2-(ethoxymethyliden)-4,4,4-trifluor-3-oxobutanoat in 70 mL absolutem Ethanol wird nach

Zugabe von 3,4 g (50 mmol) Natriumethylat drei Tage unter Rückfluss gerührt. Anschließend wird im Vakuum eingengt und der Rückstand in 50 mL Wasser aufgenommen und zweimal mit 50 mL Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Phasen werden nacheinander mit 20 mL Wasser und 20 mL gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und im Vakuum eingengt. Nach säulenchromatographischer Reinigung erhält man 9,55 g (57%) Ethyl-2-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxylat als weißen Feststoff..

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,66 (s, 1H), 4,45 (q, 2H), 1,36 (t, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 3,86 Masse (m/z) = 339 [M+H]⁺.

2-(Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carbonsäure



10

In 5 mL absolutem Ethanol werden 4,47 g (13,2 mM) Ethyl-2-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxylat gelöst. Es werden 19,8 mL (39,66 mM) 2N Natronlauge zugegeben und das Reaktionsgemisch wird 4 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Es wird durch Zugabe von 2N Salzsäure auf pH 2-3 gestellt. Der entstandene Feststoff wird abgesaugt, mit wenig Wasser gewaschen und mit Cyclohexan verrieben. Man erhält 3,74 g (91%) 2-(Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carbonsäure als weißen Feststoff.

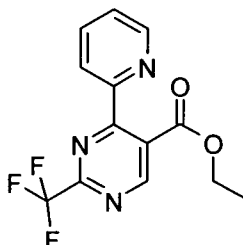
15

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.40 (s, 1H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 1,80 Masse (m/z) = 311 [M+H]⁺.

Ethyl-4-(pyridin-2-yl)-2-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxylat aus Ethyl-3-ethoxy-2-(pyridin-2-ylcarbonyl)acrylat (Herstellung analog WO 2005/123690) und 2,2,2-Trifluorpropanimidamid

20

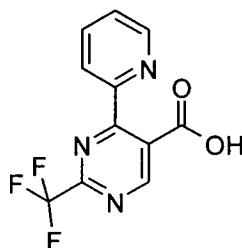


$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,28 (s, 1H), 8,69-8,71 (m, 1H), 8,27-8,30 (m, 1H), 8,09 (dt, 1H), 7,61-7,64 (m, 1H), 4,31 (q, 2H), 1,18 (t, 3H) ppm.

HPLC-MS: logP = 3,09; Masse (m/z) = 298 [M+H]⁺.

5

4-(Pyridin-2-yl)-2-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carbonsäure



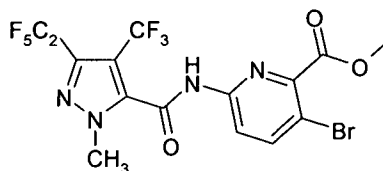
- 10 In 1,2 mL Ethanol werden 0,98 g (3,3 mmol) Ethyl-4-(pyridin-2-yl)-2-(trifluormethyl)pyrimidin-5-carboxylat gelöst. Es werden 4,95 mL (9,9 mmol) 2 M Natronlauge zugegeben und das Reaktionsgemisch wird 24 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionslösung wird durch Zugabe von 2 M Salzsäure auf pH 2-3 gestellt. Der entstandene Feststoff wird abgesaugt, mit wenig Wasser gewaschen und mit Cyclohexan verrieben. Man erhält 845 mg 4-(Pyridin-2-yl)-2-
- 15 (trifluormethyl)pyrimidin-5-carbonsäure (93%) als weißen Feststoff.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,27 (s, 1H), 8,71-8,69 (m, 1H), 8,23-8,21 (m, 1H), 8,09-8,04 (m, 1H), 7,62-7,59 (m, 1H) ppm.

HPLC-MS: logP = 1,50; Masse (m/z) = 270 [M+H]⁺.

20

3-Brom-6-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester



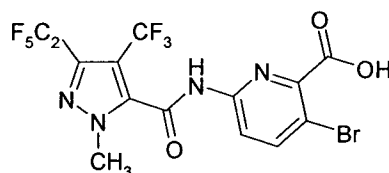
- Zu einer Lösung aus 369 mg (1,59 mM) 6-Amino-3-brom-pyridin-2-carbonsäuremethylester (vgl. WO 2008/084717) in 13,4 mL Dichlormethan werden 528, mg (1,59 mM) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäurechlorid und eine Suspension aus
- 25

213,8 mg Silber(I)-cyanid in 13,4 mL Acetonitril gegeben. Anschließend wird das Reaktionsgemisch 24 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird die Reaktionsmischung filtriert und das Lösungsmittelgemisch im Vakuum abgezogen. Der verbleibende Rückstand wird mittels Säulenchromatographie an Kieselgel gereinigt.

- 5 Man erhält 302 mg (34%) 3-Brom-6-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester.

LC-MS^{a)}: logP = 4,06, Masse (m/z) = 527 [M+H]⁺

3-Brom-6-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure



10

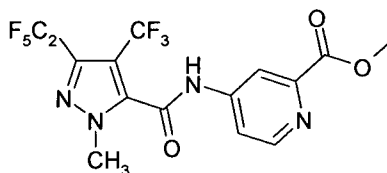
- 425 mg (0,80 mM) 3-Brom-6-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester werden in 13,6 mL Methanol p.A. suspendiert und dann mit 0,6 mL 2N Natronlauge versetzt. Das Reaktionsgemisch wird 4 Stunden bei 50 °C gerührt. Danach wird der Reaktionsansatz in Essigsäureethylester aufgenommen und einmal gegen 1N Salzsäure geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und im Vakuum eingeengt.

15

Man erhält 360 mg (65%; Reinheit: 75 %ig) 3-Brom-6-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure, die ohne weitere Reinigung für Folgereaktionen verwendet werden kann. .

- 20 LC-MS^{a)}: logP = 2,78, Masse (m/z) = 513 [M+H]⁺.

4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester



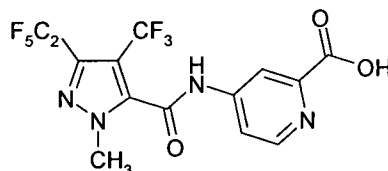
Zu einer Lösung aus 486 mg (3,19 mM) 4-Amino-pyridin-2-carbonsäuremethylester (vgl. WO 2001/074788) in 26,8 mL Dichlormethan werden 1,06 g (3,19 mM) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäurechlorid und eine Suspension aus 428 mg Silber(I)-cyanid in 26,8 mL Acetonitril gegeben. Anschließend wird das Reaktionsgemisch 24 Stunden bei
 5 Raumtemperatur gerührt. Danach wird die Reaktionsmischung filtriert und das Lösungsmittelgemisch im Vakuum abgezogen. Der verbleibende Rückstand wird mittels Säulenchromatographie an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 984 mg (69%) 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester.

10 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8,67 (d, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,80 (d, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,90 (s, 3H) ppm.

LC-MS ^{a)}: logP = 3,01, Masse (m/z) = 447 [M+H]⁺

4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure



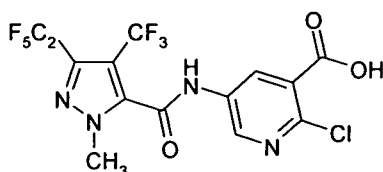
15

900 mg (2,01 mM) 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester werden in 25 mL Methanol p.A. suspendiert und dann mit 1,51 mL 2N Natronlauge versetzt. Das Reaktionsgemisch wird 10 Stunden bei 50 °C gerührt. Danach wird der Reaktionsansatz in Essigsäureethylester aufgenommen und einmal gegen
 20 1N Salzsäure geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und im Vakuum eingengt. Der verbleibende Rückstand wird mittels Säulenchromatographie an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 806,5 mg (93%) 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure.

LC-MS ^{a)}: logP = 2,06, Masse (m/z) = 433 [M+H]⁺.

25 2-Chlor-5-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)nicotinsäure



Die Reaktion mit Methyl-5-amino-2-chlornicotinat (vgl. WO 2006/050506) erfolgt analog der Reaktionsvorschrift zur Herstellung von 4-((1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl)carbonyl)-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester unter Verwendung von:

- 5 601 mg (3,21 mmol) Methyl-5-amino-2-chlornicotinat in
28,0 mL Dichlormethan,
1,06 g (3,19 mmol) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carbonylchlorid,
431 mg Silber(I)-cyanid in
28,0 mL Acetonitril.
- 10 Der verbleibende Rückstand wird mittels Säulenchromatographie an Kieselgel gereinigt. Man erhält 980 mg Methyl-2-chlor-5-((1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl)carbonyl)amino)nicotinat (62%).

¹H-NMR (600 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 8,75(s, 1H), 8,57 (s, 1H), 4,04 (s, 3H), 3,91 (s, 3H) ppm.

¹³C-NMR (150 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 164,2; 156,3; 143,5; 143,3; 140,2; 135,5; 134,0; 131,0;

- 15 126,6; 120,8; 118,3; 110,1; 109,6; 53,4; 39,3 ppm.

HPLC-MS^{a)}: logP = 3,70; Masse (m/z) = 481 [M+H]⁺.

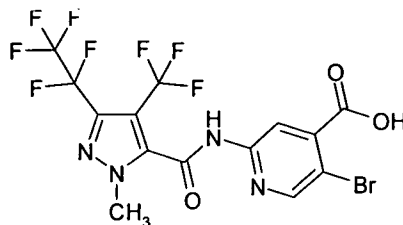
Die nachfolgende Esterspaltung erfolgt analog der Reaktionsvorschrift zur Herstellung von 4-((1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl)carbonyl)-amino)pyridin-2-carbonsäure unter Verwendung von:

- 20 940 mg (1,95 mmol) Methyl-2-chlor-5-((1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl)carbonyl)amino)nicotinat,
32,8 mL Methanol,
2,93 mL 2 M Natronlauge.

- Man erhält 912 mg 2-Chlor-5-((1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl)carbonyl)-amino)pyridin-3-carbonsäure (96%; Reinheit: 96%ig).
- 25

HPLC-MS^{a)}: logP = 2,27; Masse (m/z) = 467 [M+H]⁺.

5-Brom-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinsäure



- 5 Die Reaktion mit Methyl-2-amino-5-bromisonicotinat (vgl. WO 2006/020830; Bromierung von Methyl-2-aminoisonicotinat) erfolgt analog der Reaktionsvorschrift zur Herstellung von 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester unter Verwendung von:

738 mg (3,19 mmol) Methyl-2-amino-5-bromisonicotinat in

- 10 26,8 mL Dichlormethan,

1056 mg (3,19 mmol) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carbonylchlorid,

428 mg Silber(I)-cyanid in

26,8 mL Acetonitril.

- 15 Der verbleibende Rückstand wird mittels Säulenchromatographie an Kieselgel mit dem Laufmittelgemisch Cyclohexan:Aceton (Gradient) gereinigt. Man erhält 250 mg Methyl-5-brom-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinat (15%).

HPLC-MS^{a)}: logP = 4,04; Masse (m/z) = 527 [M+H]⁺.

- 20 Die nachfolgende Esterspaltung erfolgt analog der Reaktionsvorschrift zur Herstellung von 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure unter Verwendung von:

335 mg (0,82 mmol) Methyl-5-brom-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinat,

- 25 15,2 mL Methanol,

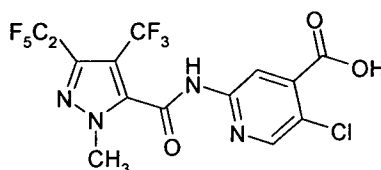
1,24 mL 2 M Natronlauge.

Man erhält 380 mg 5-Brom-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinsäure (85%), die ohne weitere Reinigung für Folgereaktionen verwendet werden kann.

HPLC-MS^{a)}: logP = 2,85; Masse (m/z) = 513 [M+H]⁺.

5

5-Chlor-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinsäure



1,50 g (9,85 mmol) Methyl-2-aminoisonicotinat werden in 15 mL *N,N*-Dimethylformamid verrührt
 10 und bei einer Temperatur von -18 °C portionsweise mit 1,83 g (13,8 mol) *N*-Chlorsuccinimid
 versetzt. Danach wird noch eine Stunde bei -18 °C weitergerührt. Zur Aufarbeitung wird der
 gesamte Reaktionsansatz in Ethylacetat aufgenommen und gegen eine wässrige Natriumthiosulfat-
 Lösung geschüttelt. Anschließend wird die organische Phase mit Wasser gewaschen, über
 Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingedunstet. Der verbleibende Rückstand wird mittels
 15 Säulenchromatographie an Kieselgel mit dem Laufmittelgemisch Cyclohexan:Aceton (Gradient)
 gereinigt. Man erhält 383mg Methyl-2-amino-5-chlorisonicotinat (16%).

¹H-NMR (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 8,00 (s, 1H), 6,78 (s, 1H), 6,25 (br. s, 2H), 3,85 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS^{a)}: logP = 1,30; Masse (m/z) = 187 [M+H]⁺.

Die Reaktion mit Methyl-2-amino-5-chlorisonicotinat erfolgt analog der Reaktionsvorschrift zur
 20 Herstellung von 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}-
 amino)pyridin-2-carbonsäuremethylester unter Verwendung von:

601 mg (3,21 mmol) Methyl-2-amino-5-chlorisonicotinat in
 28,0 mL Dichlormethan,
 1064 mg (3,21 mmol) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-carbonyl-
 25 chlorid,
 431 mg Silber(I)-cyanid in 28,0 mL Acetonitril.

Der verbleibende Rückstand wird mittels Säulenchromatographie an Kieselgel mit dem Laufmittelgemisch Cyclohexan:Aceton (Gradient) gereinigt. Man erhält 563 mg Methyl-5-chlor-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinat (36%).

- 5 Die nachfolgende Esterspaltung erfolgt analog der Reaktionsvorschrift zur Herstellung von 4-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}-amino)pyridin-2-carbonsäure unter Verwendung von:

563 mg (1,17 mmol) Methyl-5-chlor-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinat,

- 10 15,3 mL Methanol,

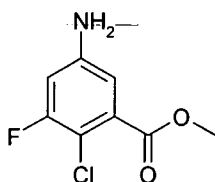
1,57 mL 2 M Natronlauge.

Man erhält 542 mg 5-Chlor-2-({[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)isonicotinsäure (97%).

HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,82; Masse (m/z) = 467 [M+1]⁺.

15

Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat



2-Amino-3-fluor-5-nitrobenzoesäure wird analog zu einem in DE 3406997 beschriebenen Verfahren ausgehend von 2-Fluoranilin hergestellt.

- 20 ¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 8,54 (dd, 1H), 7,99 (dd, 1H), 6,85 (s, 2H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 1,36; Masse (m/z) = 201 [M+H]⁺.

- 14,3 g 2-Amino-3-fluor-5-nitrobenzoesäure (71,4 mmol) werden in 500 mL Methanol suspendiert und dann tropfenweise mit 10,9 mL Thionylchlorid (150 mmol) versetzt. Anschließend wird die
 25 Reaktionlösung 16 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wird das Reaktionsgemisch am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck bis zur Trockene

eingedampft. Das Rohprodukt wird in Ethylacetat suspendiert und anschließend unter Eiskühlung vorsichtig mit ges. Natriumhydrogencarbonat-Lösung versetzt bis ein pH Wert von 8-9 in der Lösung herrscht. Die wässrige Phase wird zweimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden je einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen. Die organische Phase wird anschließend über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt.

Man erhält 12,3 g Methyl-2-amino-3-fluor-5-nitrobenzoat (68%, Reinheit 85%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_3\text{-Acetonitril}$): $\delta = 8,54$ (dd, 1H), 7,98 (dd, 1H), 6,83 (s, 2H), 3,91 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,12$; Masse (m/z) = 215 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

1,51 g Kupfer(II)chlorid (11,2 mmol) und 1,66 mL *tert*-Butylnitrit (14,0 mmol) werden in 20 mL absolutem Acetonitril suspendiert und auf 70°C erwärmt. Zu diesem Reaktionsgemisch wird eine Lösung von 2,0 g Methyl-2-amino-3-fluor-5-nitrobenzoat (9,34 mmol) in 20 mL absolutem Acetonitril tropfenweise hinzugefügt. Das Reaktionsgemisch wird 4 Stunden bei 70°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird das Reaktionsgemisch auf 1 N Salzsäure gegossen. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und anschließend am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 1,28 g Methyl-2-Chlor-3-fluor-5-nitrobenzoat (59%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_3\text{-Acetonitril}$): $\delta = 8,43$ (dd, 1H), 8,21 (dd, 1H), 3,96 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,60$; Masse (m/z) = 234 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

25

1,20 g Eisenpulver wird in 20 mL 5%-iger Essigsäure suspendiert und mit einer Lösung von 1,0 g Methyl-2-Chlor-3-fluor-5-nitrobenzoat in einem Gemisch aus 25 mL Ethylacetat und 8 mL Eisessig versetzt. Die Innentemperatur wird dabei unter 45°C gehalten. Das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und anschließend über Celite filtriert. Das Filtrat wird mit Wasser verdünnt und die wässrige Phase dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten

30

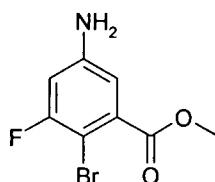
organischen Phasen werden zweimal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und zweimal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt.

Man erhält 0,86 g Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat (79%).

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_3\text{-Acetonitril}$): $\delta = 6,85$ (dd, 1H), 6,64 (dd, 1H), 4,52 (s, 2H), 3,85 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 1,89$; Masse (m/z) = 204 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Methyl-5-Amino-2-brom-3-fluorbenzoat



2,09 g Kupfer(II)bromid (9,34 mmol) und 1,67 mL *tert*-Butylnitrit (14,0 mmol) werden in 20 mL absolutem Acetonitril suspendiert und auf 70°C erwärmt. Zu diesem Reaktionsgemisch wird eine Lösung von 2,0 g Methyl-2-amino-3-fluor-5-nitrobenzoat (9,34 mmol) in 20 mL absolutem Acetonitril tropfenweise hinzugefügt. Das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei 70°C gerührt.

- 15 Nach dem Abkühlen wird das Reaktionsgemisch auf 1 N Salzsäure gegossen. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und anschließend am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

- 20 Man erhält 1,5 g Methyl-2-brom-3-fluor-5-nitrobenzoat (58%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_3\text{-Acetonitril}$): $\delta = 8,37$ (dd, 1H), 8,15 (dd, 1H), 3,95 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,66$; Masse (m/z) = 280 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

- 25 Die nachfolgende Reduktion der Nitrofunktion erfolgt analog der Vorschrift zur Herstellung von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat.

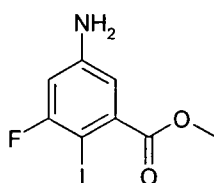
Man erhält Methyl-5-Amino-2-brom-3-fluorbenzoat (96%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_3\text{-Acetonitril}$): $\delta = 6,82$ (dd, 1H), $6,61$ (dd, 1H), $4,55$ (s, 2H), $3,85$ (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 1,93$; Masse (m/z) = 250 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

5

Methyl-5-Amino-2-iod-3-fluorbenzoat



0,9 mL Diiodmethan (11,2 mmol) und 1,67 mL *tert*-Butylnitrit (14,0 mmol) werden in 20 mL absolutem Acetonitril suspendiert und auf 70°C erwärmt. Zu diesem Reaktionsgemisch wird eine
10 Lösung von 2,0 g Methyl-2-amino-3-fluor-5-nitrobenzoat (9,34 mmol) in 20 mL absolutem Acetonitril tropfenweise hinzugefügt. Das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei 70°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird das Reaktionsgemisch auf 1 N Salzsäure gegossen. Die wässrige Phase wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und
15 anschließend am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 0,95 g Methyl-2-iod-3-fluor-5-nitrobenzoat (26%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_3\text{-Acetonitril}$): $\delta = 8,30$ (dd, 1H), $8,04$ (dd, 1H), $3,96$ (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,76$; Masse (m/z) = 326 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

20

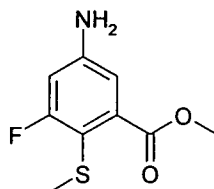
Die nachfolgende Reduktion der Nitrofunktion erfolgt analog der Vorschrift zur Herstellung von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat.

Man erhält Methyl-5-Amino-2-iod-3-fluorbenzoat (86%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 6,79$ (d, 1H), $6,56$ (dd, 1H), $5,68$ (s, 2H), $3,82$ (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,04; Masse (m/z) = 296 [M+H]⁺.

Methyl-5-amino-3-fluor-2-(methylsulfanyl)benzoat



- 5 1,0 mL Dimethyldisulfid (11,2 mmol) und 1,67 mL *tert*-Butylnitrit (14,0 mmol) werden in 20 mL absolutem Acetonitril suspendiert und auf 70°C erwärmt. Zu diesem Reaktionsgemisch wird eine Lösung von 2,0 g Methyl-2-amino-3-fluor-5-nitrobenzoat (9,34 mmol) in 20 mL absolutem Acetonitril tropfenweise hinzugefügt. Das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei 70°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird das Reaktionsgemisch auf 1 N Salzsäure gegossen. Die wässrige Phase
- 10 wird dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und anschließend am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 0,75 g Methyl-3-fluor-2-(methylsulfanyl)-5-nitrobenzoat (22%).

- 15 ¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 8,27 (dd, 1H), 8,05 (dd, 1H), 3,93 (s, 3H), 2,56 (d, 3H) ppm.

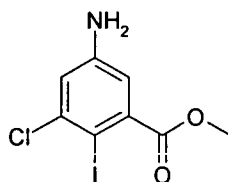
HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,75; Masse (m/z) = 246 [M+H]⁺.

- Die nachfolgende Reduktion der Nitrofunktion erfolgt analog der Vorschrift zur Herstellung von
- 20 Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat.

Man erhält Methyl-5-amino-3-fluor-2-(methylsulfanyl)benzoat (66%).

¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 6,60 (dd, 1H), 6,51 (dd, 1H), 4,57 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,27 (s, 3H) ppm.

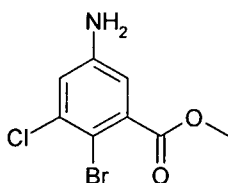
HPLC-MS ^{a)}: logP = 1,84; Masse (m/z) = 216 [M+H]⁺.

Methyl-5-Amino-3-chlor-2-iodbenzoat

Die Herstellung von Methyl-5-Amino-3-chlor-2-iodbenzoat erfolgt ausgehend von 2-Chloranilin in Analogie zu denen in der Synthese von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat und Methyl-5-Amino-3-fluor-2-iodbenzoat beschriebenen Verfahren.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril): $\delta = 6,94$ (d, 1H), $6,75$ (d, 1H), $4,51$ (s, 2H), $3,85$ (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,23$; Masse (m/z) = 312 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

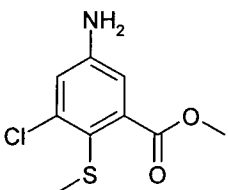
Methyl-5-Amino-2-brom-3-chlorbenzoat

10 Die Herstellung von Methyl-5-Amino-2-brom-3-chlorbenzoat erfolgt ausgehend von 2-Chloranilin in Analogie zu denen in der Synthese von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat und Methyl-5-Amino-2-brom-3-fluorbenzoat beschriebenen Verfahren.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril): $\delta = 6,92$ (d, 1H), $6,82$ (d, 1H), $4,50$ (s, 2H), $3,85$ (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,17$; Masse (m/z) = 266 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

15

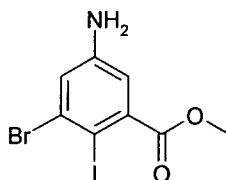
Methyl-5-Amino-3-chlor-2-(methylsulfanyl)benzoat

Die Herstellung von Methyl-5-Amino-3-chlor-2-(methylsulfanyl)benzoat erfolgt ausgehend von 2-Chloranilin in Analogie zu denen in der Synthese von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat und Methyl-5-Amino-3-fluor-2-(methylsulfanyl)benzoat beschriebenen Verfahren.

¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 6,86 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 4,52 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,27 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,12; Masse (m/z) = 232 [M+H]⁺.

Methyl-5-Amino-3-brom-2-iodbenzoat

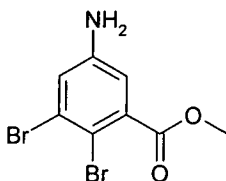


10 Die Herstellung von Methyl-5-Amino-3-brom-2-iodbenzoat erfolgt ausgehend von 2-Bromanilin in Analogie zu denen in der Synthese von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat und Methyl-5-Amino-3-fluor-2-iodbenzoat beschriebenen Verfahren.

¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 7,12 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 4,49 (s, 2H), 3,85 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,33; Masse (m/z) = 356 [M+H]⁺.

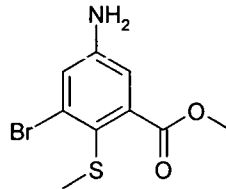
15 Methyl-5-Amino-2,3-dibrombenzoat



Die Herstellung von Methyl-5-Amino-2-brom-3-chlorbenzoat erfolgt ausgehend von 2-Bromanilin in Analogie zu denen in der Synthese von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat und Methyl-5-Amino-2-brom-3-fluorbenzoat beschriebenen Verfahren.

20 ¹H-NMR (400 MHz, d₃-Acetonitril): δ = 7,10 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 4,48 (s, 2H), 3,85 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: logP = 2,23; Masse (m/z) = 310 [M+H]⁺.

Methyl-5-Amino-3-brom-2-(methylsulfanyl)benzoat

Die Herstellung von Methyl-5-Amino-3-chlor-2-(methylsulfanyl)benzoat erfolgt ausgehend von 2-
5 Bromanilin in Analogie zu denen in der Synthese von Methyl-5-Amino-2-chlor-3-fluorbenzoat und
Methyl-5-Amino-3-fluor-2-(methylsulfanyl)benzoat beschriebenen Verfahren.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_3 -Acetonitril): $\delta = 7,07$ (d, 1H), $6,66$ (d, 1H), $3,84$ (s, 3H), $2,28$ (s, 3H) ppm.

HPLC-MS ^{a)}: $\log P = 2,19$; Masse (m/z) = 278 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Biologische Beispiele

Beispiel A

Ctenocephalides felis oral (CTECFE)

Lösungsmittel: 1 Gewichtsteil Dimethylsulfoxid

- 5 Zwecks Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 mL Dimethylsulfoxid. Ein Teil des Konzentrats wird mit citriertem Rinderblut verdünnt und die gewünschte Konzentration hergestellt.

20 nüchterne adulte Flöhe (*Ctenocephalides felis*) werden in eine Kammer eingesetzt, die oben und unten mit Gaze verschlossen ist. Auf die Kammer wird ein Metallzylinder gestellt, dessen
10 Unterseite mit Parafilm verschlossen ist. Der Zylinder enthält die Blut-Wirkstoffzubereitung, die von den Flöhen durch die Parafilmmembran aufgenommen werden kann. Nach 2 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Flöhe abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass kein Floh abgetötet wurde.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
15 von 80 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

Ia-11, Ia-26, Ia-28

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
von 90 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

Ia-17, Ia-29, Ia-30

20 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 95 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

Ia-16, Ia-21, Ia-31

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
von 100 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

25 Ia-2, Ia-8, Ia-15, Ia-18, Ia-22

Beispiel B**Lucilia cuprina-Test (LUCICU)**

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5
5 mL Dimethylsulfoxid und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte
Konzentration. Gefäße, die Pferdefleisch enthalten, das mit der Wirkstoffzubereitung der
gewünschten Konzentration behandelt wurde, werden mit *Lucilia cuprina* Larven besetzt.

Nach 2 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Larven abgetötet
wurden; 0 % bedeutet, dass keine Larven abgetötet wurden.

10 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
von 80 % bei einer Aufwandmenge von 20 ppm :

Ia-56

Die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele zeigten eine Wirkung von 90 % bei einer
Aufwandmenge von 100 ppm :

15 Ia-16, Ia-36

Die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele zeigten eine Wirkung von 100 % bei einer
Aufwandmenge von 100 ppm :

Ia-8, Ia-11, Ia-15, Ia-17, Ia-18, Ia-21, Ia-22, Ia-26, Ia-28, Ia-29, Ia-30

Die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele zeigten eine Wirkung von 100 % bei einer
20 Aufwandmenge von 20 ppm :

Ia-46, Ia-52

Beispiel C**Musca domestica–Test (MUSCDO)**

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5
5 mL Dimethylsulfoxid und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.
Gefäße, die einen Schwamm enthalten, der mit der Wirkstoffzubereitung der gewünschten
Konzentration behandelt wurde, werden mit *Musca domestica Adulten* besetzt.

Nach 2 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Fliegen abgetötet
wurden; 0 % bedeutet, dass keine Fliegen abgetötet wurden.

10 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
von 80 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

Ia-26

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
von 90 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

15 Ia-22

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung
von 100 % bei einer Aufwandmenge von 100 ppm :

Ia-17

Beispiel D**Boophilus microplus –Test (BOOPMI Injektion)**

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 mL Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration. Die Wirkstofflösung wird in das Abdomen (*Boophilus microplus*) injiziert, die Tiere werden in Schalen überführt und in einem klimatisierten Raum aufbewahrt. Die Wirkungskontrolle erfolgt auf Ablage fertiler Eier. Nach 7 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass keine Zecke fertile Eier gelegt hat.

10 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90 % bei einer Aufwandmenge von 20 µg / Tier :

Ia-32

Die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele zeigten eine Wirkung von 100 % bei einer Aufwandmenge von 20 µg / Tier :

15 Ia-2, Ia-8, Ia-11, Ia-15, Ia-16, Ia-17, Ia-18, Ia-21, Ia-22, Ia-26, Ia-28, Ia-29, Ia-30, Ia-31, Ia-36, Ia-46, Ia-52, Ia-55, Ia-56

Beispiel E**Phaedon-Test (PHAECO Spritzbehandlung)**

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton
1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator: 0,5 Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Chinakohlblattscheiben (*Brassica pekinensis*) werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt und nach dem Abtrocknen mit Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt.

Nach 7 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

15 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha:

Ia-38, Ia-9

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

Ia-1, Ia-2, Ia-3, Ia-4, Ia-6, Ia-8, Ia-10, Ia-11, Ia-13, Ia-15, Ia-16, Ia-17, Ia-18, Ia-19, Ia-20,

20 Ia-21, Ia-22, Ia-23, Ia-24, Ia-25, Ia-26, Ia-27, Ia-28, Ia-29, Ia-30, Ia-31, Ia-32, Ia-33, Ia-34,

Ia-35, Ia-36, Ia-37, Ia-39, Ia-41, Ia-42, Ia-43, Ia-44, Ia-46, Ia-47, Ia-48, Ia-49, Ia-50, Ia-51, Ia-52, Ia-53, Ia-54, Ia-55, Ia-56, Ia-57, Ic-1, Id-1, Id-2, Ie-1, If-1

25 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100 % bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha :

Ia-7

Beispiel F**Spodoptera frugiperda-Test (SPODFR Spritzbehandlung)**

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton
 1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator: 0,5 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Maisblattscheiben (*Zea mays*) werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt und nach dem Abtrocknen mit Raupen des Heerwurms (*Spodoptera frugiperda*) besetzt. Nach 7 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupe abgetötet wurde.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

15 Ia-4, Ia-35

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 83 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

Ia-47

20 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

Ia-2, Ia-3, Ia-6, Ia-8, Ia-11, Ia-12, Ia-13, Ia-15, Ia-16, Ia-17, Ia-18, Ia-19, Ia-20, Ia-21, Ia-22, Ia-23, Ia-24, Ia-25, Ia-26, Ia-27, Ia-28, Ia-29, Ia-30, Ia-31, Ia-32, Ia-33, Ia-34, Ia-36, Ia-37, Ia-39, Ia-40, Ia-42, Ia-43, Ia-44, Ia-48, Ia-49, Ia-50, Ia-51, Ia-52, Ia-53, Ia-54, Ia-55, Ia-56, Ia-57, Ic-1, Ie-1, If-1

Beispiel G**Tetranychus-Test, OP-resistent (TETRUR Spritzbehandlung)**

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton
 1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator: 0,5 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Bohnenblattscheiben (*Phaseolus vulgaris*), die von allen Stadien der Gemeinen Spinnmilbe (*Tetranychus urticae*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt.

Nach 6 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Spinnmilben abgetötet wurden.

15 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

Ia-6, Ia-8, Ia-16, Ia-17, Ia-21, Ia-28, Ia-34, Ia-47, Ia-49, Ia-50, Ia-54, Ia-1

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

Ia-2, Ia-11, Ia-13, Ia-15, Ia-23, Ia-26, Ia-30, Ia-33, Ia-51, Ia-53, Ia-55, Ia-57

20 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha:

Ia-18, Ia-19, Ia-22, Ia-29, Ia-46, Ia-48, Ia-52, Ia-56

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80 % bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha :

25 Ia-7

Beispiel H**Myzus persicae Test (TMYZUPE Spritzbehandlung)**

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton
1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator: 0,5 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Chinakohl- (*Brassica pekinensis*) blattscheiben, die von allen Stadien der Grünen Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae ossypium hirsutum*) (*Myzus persicae*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt.

Nach 6 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

15 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80 % bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha :

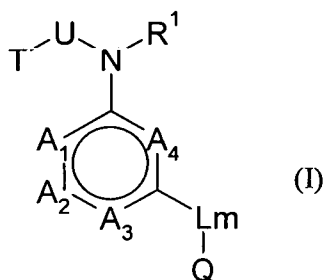
Ia-52

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80 % bei einer Aufwandmenge von 20 g/ha :

Ia-45

Patentansprüche

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I),



in denen

- 5 R¹ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, Cyan-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₂-Alkoxy)-(C₁-C₂-alkyl), Aryl(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl(C₁-C₃-alkyl) steht,

die chemischen Gruppierungen

- 10 A₁ für CR², einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel oder eine Bindung,
- A₂ für CR³ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,
- A₃ für CR⁴ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel und
- 15 A₄ für CR⁵ oder einen gegebenenfalls mit G substituierten Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel stehen,

unter der Maßgabe, dass nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A₁ bis A₄ gleichzeitig für Stickstoff stehen;

- 20 R², R³, R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, CN, NO₂, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)amino, N,N-Di-(C₁-

C₆-alkyl)amino, N-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Cycloalkyl)aminocarbonyl oder (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, stehen;

5 wenn keine der Gruppierungen A₂ und A₃ für Stickstoff steht, können R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält, oder

wenn keine der Gruppierungen A₁ und A₂ für Stickstoff steht, können R² und R³ gemeinsam mit dem Kohlenstoff an das sie gebunden sind einen 6-gliedrigen Ring bilden, der 0, 1 oder 2 Stickstoffatome enthält;

10 G für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenocycloalkyl und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;

U für eine Gruppierung C(=W), SO oder SO₂ steht,

wobei

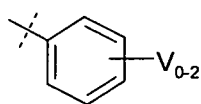
15 W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den Gruppierungen -C(=O)NH-, -C(=O)NR⁶, -C(=O)NHSO₂-, bei der die rechte Seite der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,

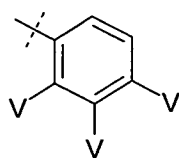
20 R⁶ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl), C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl steht;

m den Wert 1 annimmt;

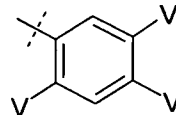
Q für einen der unten dargestellten Reste (Q-1) – (Q-8) steht,



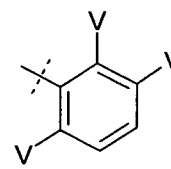
(Q-1)



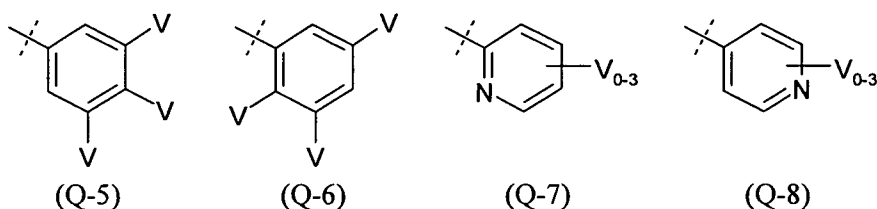
(Q-2)



(Q-3)



(Q-4)



- V für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino steht;
- 5
- T für einen der Reste (T-1), (T-2), (T-3), (T-4), (T-5), (T-8), (T-9), (T-11), (T-12), (T-13), (T-14), (T-17), (T-18), (T-19), (T-20), (T-21), (T-22), (T-23), (T-24), (T-25), (T-26), (T-27), (T-28), (T-29), (T-30), (T-31), (T-33), (T-34), (T-35), (T-44), (T-45), (T-46), (T-47), (T-48), (T-49), (T-50), (T-51), (T-53), (T-55), (T-57), (T-58), (T-59), (T-60) steht,
- 10
- wobei
- Z₁ für ein gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl,, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₃-alkyl), Aryl-(C₁-C₃-alkyl), Heteroaryl-(C₁-C₃-alkyl) oder gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht,
- 15
- Z₂ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, -C(=W)NR⁷R⁶, -C(=W)OR⁸, -S(O)₂NR⁹R¹⁰, -S(O)_pR¹¹, -S(O)(=NR¹²)R¹³ und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;
- 20
- Z₃ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl und gegebenenfalls mit R¹⁴ substituiertes Phenyl und Pyridinyl steht;
- 25

- 5 R⁷ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- 5 R⁸ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R⁶ substituierten Gruppierung C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);
- 10 R⁹ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;
- R¹⁰ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁵ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-Alkyl);
- 15 R¹¹ ausgewählt ist aus den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl) und C₁-C₄-Haloalkyl;
- 20 ~~R¹² ausgewählt ist aus Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl), (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl), (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;~~
- R¹³ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁶ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, (C₁-C₂-Alkyl)-(C₃-C₆-cycloalkyl) und (C₃-C₆-Cycloalkyl)-(C₁-C₂-alkyl);
- 25 R¹⁴ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl;
- 30 R¹⁵ ausgewählt ist aus Wasserstoff oder den gegebenenfalls mit R¹⁷ substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl,

C₁-C₆-Alkylsulfonyl, -CN, -NO₂ sowie gegebenenfalls mit R¹⁶ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;

5 R¹⁶ ausgewählt ist aus Halogen, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, oder gegebenenfalls mit R¹⁸ substituiertem Phenyl oder Pyridyl;

10 R¹⁷ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂ oder den gegebenenfalls substituierten Gruppierungen C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-Alkylamino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl und *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, wobei,

15 R¹⁸ ausgewählt ist aus Halogen, -OH, -NH₂, -COOH, -CN, -NO₂, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)amino, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl, *N*-(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, *N,N*-Di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl; oder

20 L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

25 2. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

30 R¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, *n*-Propyl, Isopropyl, *n*-Butyl, Isobutyl, *sec*-Butyl, *tert*-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, *n*-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, *sec*-Butylcarbonyl, *tert*-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, *n*-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, *sec*-Butoxycarbonyl, *tert*-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl steht;

R² und R⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Fluor und Chlor stehen und

R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl und *N*-Cyclopropylaminocarbonyl stehen;

G für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Pentafluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, 2-Methoxyethoxymethyl, Methylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Phenyl, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Chlor-4-trifluormethyl-phenyl steht;

wobei

U für C(=W) und

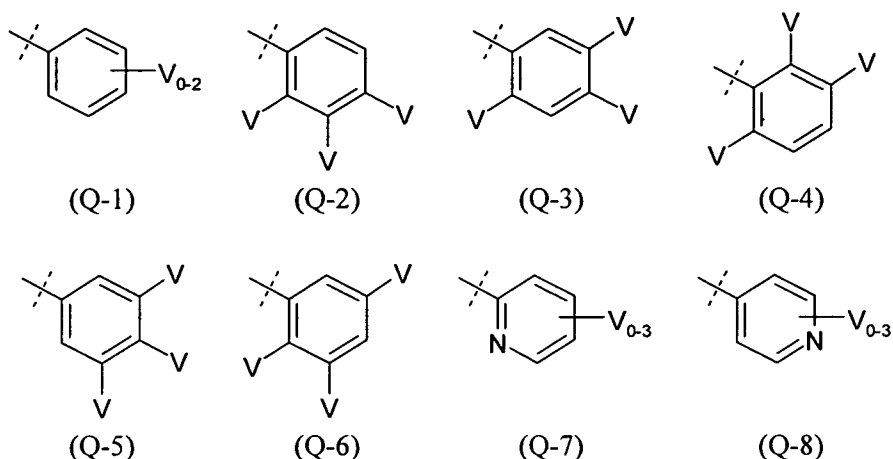
W für Sauerstoff steht;

L für eine bivalente chemische Gruppierung steht, die ausgewählt ist aus den Gruppierungen -C(=O)NH-, -C(=O)NR⁶, -C(=O)NHSO₂-, bei der die rechte Seite der Gruppierung direkt an den Rest Q anknüpft und wobei,

R⁶ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, sec-Butylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Pyrid-2-yl-methyl, Pyrid-3-yl-methyl und Pyrid-4-yl-methyl steht;

m den Wert 1 annimmt;

Q für einen der unten dargestellten Reste (Q-1) – (Q-8) steht;



V für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Pentafluor-tert-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, Methylthio, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl steht;

T für einen der Reste (T-8), (T-9), (T-11), (T-17), (T-18), (T-19), (T-21), (T-29), (T-35), (T-44), (T-49), (T-50), (T-53), (T-55), (T-57) steht,

15 wobei

Z₁ für Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Pentafluor-tert-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Trifluormethoxy-1,1,2,2-tetrafluorethoxy-difluormethyl, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopropyl-hydroxymethyl, Cyclopropyl-fluormethyl,

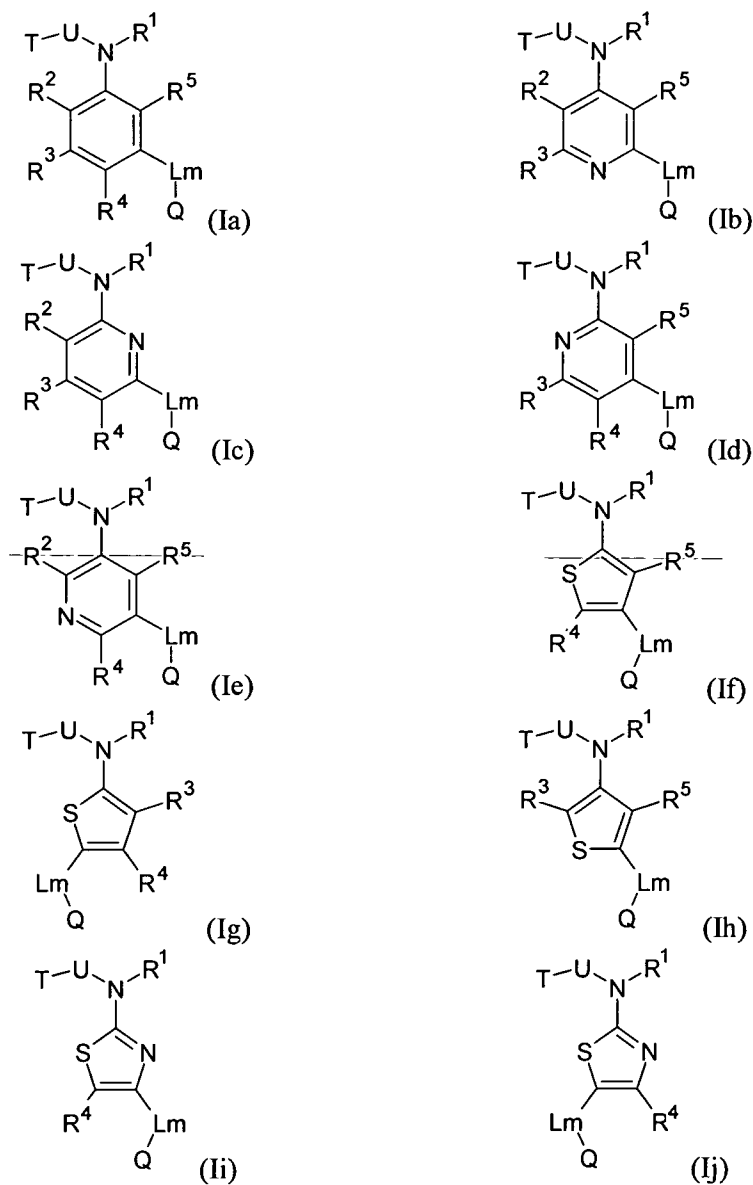
- 5 Cyclopropylcarbonyl, 2,2,2-Trifluoroethoxy, 1-Trifluormethylethoxy, 3,3,3,2,2-Pentafluoropropoxy, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Fluorphenyl, 2-Methylphenyl, 3-Methylphenyl, 4-Methylphenyl, 3-Trifluormethylphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 4-Nitrophenyl, 4-(*tert*-Butyl)phenyl, 4-Methoxyphenyl, 4-Phenoxyphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 3,4-Dichlorphenyl, 3,5-Dichlorphenyl, 2,5-Dichlorphenyl, 2,6-Difluorphenyl, 4-Trifluormethoxyphenyl, 4-Cyanophenyl, 2-Trifluormethyl-pyrid-5-yl, 3-Chlor-5-trifluormethyl-pyrid-2-yl, (3,5-Bis(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl)-methyl, (3,5-Bis(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-1-yl)-methyl, (3,5-Bis(trifluormethyl)-1H-triazol-1-yl)-methyl, (2-Methyl-2-H-tetrazol-5-yl)-methyl, (5-Trifluormethyl-2H-tetrazol-2-yl)-methyl, (3,5-Dichlorphenyl)-methyl, (3,5-Bis(trifluormethyl)phenyl)-methyl, (2,4-Dichlorphenyl)-methyl, (2,6-Dichlorphenyl)-methyl, (4-Chlorphenyl)-methyl, (4-Trifluormethylphenyl)-methyl steht,
- 10
- Z₂ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, Ethinyl, 1-Propinyl, 1-Butinyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Brommethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Pentafluor-*tert*-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, Methylthio, 25 Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl, *N,N*-Dimethylamino, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Trifluormethylphenyl steht;
- Z₃ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl,, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Pentafluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, 2-Methoxyethoxymethyl, Methylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, sec-Butoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Phenyl, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Chlor-4-trifluormethyl-phenyl steht;
- 30

ferner können

L, Q und R⁴ zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der gegebenenfalls 0, 1 oder 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom enthält.

5

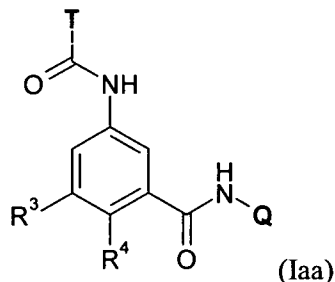
3. Verbindungen der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij),



wobei die Reste T, U, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, Lm und Q die in den Ansprüchen 1 oder 2 angegebenen Bedeutungen haben.

10

4. Verbindungen der allgemeinen Formel (Iaa),



in denen

5 R^3 für einen Rest ausgewählt aus Fluor, Chlor oder Brom steht,

R^4 für einen Rest ausgewählt aus Fluor, Chlor, Brom, Iod oder S-Methyl steht,

der Rest T ausgewählt sein kann aus

1-Ethyl-3,4-Bis(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-4-
 (trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3,4-Bis(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-
 10 yl, 2-(Pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)pyrimidin-5-yl, 2-(Trifluormethyl)-1,3- thiazol-4-
 yl, 2-(Trifluormethyl)-1,3-thiazol-4-yl, 2,4-Bis(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl, 2-Methyl-
 6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl, 4-(Difluormethyl)-2-(pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl, 4-
 (Pyrid-2-yl)-2-(trifluormethyl)-pyrimidin-5-yl, 4-Brom-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-1*H*-
 pyrazol-5-yl, 4-Brom-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1*H*-pyrazol-5-yl, 4-Cyclopropyl-2-
 15 (pentafluorethyl)pyrimidin-5-yl

und

der Rest Q ausgewählt sein kann aus

Pyridin-4-yl, Pyridin-3-yl, 2-Fluorphenyl, 3-Fluorphenyl, 4-Fluorphenyl, 4-Chlorpyridin-3-
 yl, 2-Chlorpyridin-4yl, 6-Chlorpyridin-3-yl, Pyridin-2-yl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl,
 20 4-Chlorphenyl, 4-Methoxyphenyl, 2-Chlorpyridin-3-yl, Phenyl, 3-Methoxyphenyl, 6-
 Chlorpyridin-2-yl, 2,4-Difluorphenyl, 4-Fluor-2-methylphenyl, 4-Chlorpyridin-2-yl, 4-
 Fluor-3-methylphenyl, 2-Chlor-4-fluor-5-methylphenyl, 3-Chlor-4-fluor-2-methylphenyl,
 5-Chlorpyridin-2-yl, 4-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl, 3,4-Dichlorphenyl, 3,4,5-
 Trichlorphenyl, 4-(Trifluormethyl)phenyl, 3-(Trifluormethyl)phenyl.

5. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 oder Verbindungen der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) oder Verbindungen der allgemeinen Formel (Iaa) gemäß Anspruch 4 zur Bekämpfung von Insekten, Spinnentieren und Nematoden.
- 5
6. Pharmazeutische Zusammensetzungen, enthaltend wenigstens eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4.
7. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 oder Verbindungen der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) gemäß Anspruch 3 oder der Verbindungen allgemeinen Formel (Iaa) gemäß Anspruch 4 zur Herstellung pharmazeutischer Zusammensetzungen zur Bekämpfung von Parasiten auf Tieren.
- 10
8. Verfahren zur Herstellung von Pflanzenschutzmitteln enthaltend Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 oder der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) gemäß Anspruch 3 oder Verbindungen der allgemeinen Formel (Iaa) gemäß Anspruch 4 sowie übliche Streckmittel und/oder oberflächenaktive Substanzen.
- 15
9. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 oder der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) gemäß Anspruch 3 oder Verbindungen der allgemeinen Formel (Iaa) gemäß Anspruch 4 auf die Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.
- 20
10. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 sowie der Verbindungen der allgemeinen Formeln (Ia) bis (Ij) gemäß Anspruch 3 oder Verbindungen der allgemeinen Formel (Iaa) gemäß Anspruch 4 zum Schutz des Vermehrungsmaterials von Pflanzen, insbesondere von Saatgut.
- 25

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2010/002944

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER					
INV.	C07D213/56	C07D231/14	C07D239/36	C07D277/56	C07D401/12
	C07D417/12	A01N43/40	A01N43/56	A01N43/78	A01N43/54
	A61P33/00	A61K31/381			

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 A01P A61K A61P

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, 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.
A	EP 1 714 958 A (MITSUI CHEMICALS INC [JP]) 25 October 2006 (2006-10-25) compound 321	1-10
A	WO 2008/074427 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE [FR]; GODFREY CHRISTOPHER) 26 June 2008 (2008-06-26) cited in the application compound 1.14	1-10
A	WO 2007/128410 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE [FR]; DURIEUX PATRICIA [F]) 15 November 2007 (2007-11-15) cited in the application compounds B6,C11	1-10
	----- -/--	

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	"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
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"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
"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)	"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.
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 3 August 2010	Date of mailing of the international search report 10/08/2010
---	---

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 Skulj, Primoz
--	--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2010/002944

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 00/27823 A1 (BLACK JAMES FOUNDATION [GB]; KALINDJIAN SARKIS BARRET [GB]; BUCK ILDIK) 18 May 2000 (2000-05-18) example 101	1,3
X	EP 1 911 751 A (MITSUI CHEMICALS INC [JP]) 16 April 2008 (2008-04-16) cited in the application the whole document tables 1-1-1-25; compounds 1.122-1.135,1.363,1-364	1-10

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

see supplemental sheet

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority has found that the international application contains multiple (groups of) inventions, as follows:

1. Claims 1-10 (in part)

Compounds of formula (I), wherein Q is a phenyl having less than three substituents (radical Q-1), and uses thereof.

2. Claims 1-10 (in part)

Compounds of formula (I), wherein Q is a phenyl having three non-symmetrical substituents (radicals Q-2 to Q-4, and Q-6), and uses thereof.

3. Claims 1-10 (in part)

Compounds of formula (I), wherein the ring Q is a pyridyl (radicals Q-7, Q-8), and uses thereof.

4. Claims 1-10 (in part)

Compounds of formula (I), wherein the ring Q is a symmetrically substituted phenyl (radical Q-5), and uses thereof.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2010/002944

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 1714958	A	25-10-2006	AR 047456 A1	18-01-2006
			AU 2004315003 A1	11-08-2005
			BR PI0418471 A	05-06-2007
			CA 2554437 A1	11-08-2005
			WO 2005073165 A1	11-08-2005
			KR 20060110001 A	23-10-2006
			KR 20080052692 A	11-06-2008
			NZ 548793 A	24-12-2009
			US 2007275980 A1	29-11-2007
WO 2008074427	A	26-06-2008	AR 064490 A1	08-04-2009
			AU 2007334936 A1	26-06-2008
			EA 200970609 A1	30-12-2009
			EP 2120556 A1	25-11-2009
			JP 2010513346 T	30-04-2010
			KR 20090101903 A	29-09-2009
			US 2010056639 A1	04-03-2010
			WO 2007128410	A
JP 2009535311 T	01-10-2009			
US 2009192175 A1	30-07-2009			
WO 0027823	A1	18-05-2000		
			AU 1061500 A	29-05-2000
			BR 9915194 A	07-08-2001
			CA 2346108 A1	18-05-2000
			CN 1325385 A	05-12-2001
			DE 69926148 D1	18-08-2005
			EP 1178969 A1	13-02-2002
			HU 0104038 A2	29-05-2002
			JP 2002529455 T	10-09-2002
			NO 20012288 A	02-07-2001
			PL 347591 A1	08-04-2002
			US 6479531 B1	12-11-2002
			EP 1911751	A
AU 2006260299 A1	28-12-2006			
CA 2612976 A1	28-12-2006			
CN 101203484 A	18-06-2008			
WO 2006137376 A1	28-12-2006			
KR 20080016961 A	22-02-2008			
KR 20090130887 A	24-12-2009			
NZ 565245 A	30-07-2010			
US 2009233962 A1	17-09-2009			
ZA 200800608 A	24-06-2009			

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2010/002944

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. C07D213/56 C07D231/14 C07D239/36 C07D277/56 C07D401/12
C07D417/12 A01N43/40 A01N43/56 A01N43/78 A01N43/54
A61P33/00 A61K31/381

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
C07D A01P A61K A61P

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, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 1 714 958 A (MITSUI CHEMICALS INC [JP]) 25. Oktober 2006 (2006-10-25) Verbindung 321	1-10
A	WO 2008/074427 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE [FR]; GODFREY CHRISTOPHER) 26. Juni 2008 (2008-06-26) in der Anmeldung erwähnt Verbindung 1.14	1-10
A	WO 2007/128410 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE [FR]; DURIEUX PATRICIA [F]) 15. November 2007 (2007-11-15) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen B6,C11	1-10
	-/--	

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

- * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen
- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahelegend ist
- "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
3. August 2010	10/08/2010

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 Skulj, Primoz
--	--

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 00/27823 A1 (BLACK JAMES FOUNDATION [GB]; KALINDJIAN SARKIS BARRET [GB]; BUCK ILDIK) 18. Mai 2000 (2000-05-18) Beispiel 101 -----	1,3
X	EP 1 911 751 A (MITSUI CHEMICALS INC [JP]) 16. April 2008 (2008-04-16) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument Tabellen 1-1-1-25; Verbindungen 1.122-1.135,1.363,1-364 -----	1-10

Feld Nr. II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein internationaler Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche diese Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, dass eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich

3. Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefasst sind.

Feld Nr. III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Diese internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung solcher Gebühren aufgefordert.

3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.

4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Dieser internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfasst:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Der Anmelder hat die zusätzlichen Recherchegebühren unter Widerspruch entrichtet und die gegebenenfalls erforderliche Widerspruchsgebühr gezahlt.
- Die zusätzlichen Recherchegebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt, jedoch wurde die entsprechende Widerspruchsgebühr nicht innerhalb der in der Aufforderung angegebenen Frist entrichtet.
- Die Zahlung der zusätzlichen Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-10(teilweise)

Verbindungen der Formel I, wo Q ein Phenyl mit weniger als 3 Substituenten ist (Rest Q-1), und deren Verwendungen

2. Ansprüche: 1-10(teilweise)

Verbindungen der Formel I, wo Q ein Phenyl mit 3 nicht symmetrischen Substituenten ist (Reste Q-2 bis Q-4, und Q-6), und deren Verwendungen

3. Ansprüche: 1-10(teilweise)

Verbindungen der Formel I wo Ring Q ein Pyridyl ist (Reste Q-7, Q-8), und deren Verwendungen.

4. Ansprüche: 1-10(teilweise)

Verbindungen der Formel I wo Ring Q ein symmetrisch substituiertes Phenyl ist (Rest Q-5), und deren Verwendungen.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2010/002944

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 1714958	A	25-10-2006	AR 047456 A1 18-01-2006
			AU 2004315003 A1 11-08-2005
			BR PI0418471 A 05-06-2007
			CA 2554437 A1 11-08-2005
			WO 2005073165 A1 11-08-2005
			KR 20060110001 A 23-10-2006
			KR 20080052692 A 11-06-2008
			NZ 548793 A 24-12-2009
			US 2007275980 A1 29-11-2007
WO 2008074427	A	26-06-2008	AR 064490 A1 08-04-2009
			AU 2007334936 A1 26-06-2008
			EA 200970609 A1 30-12-2009
			EP 2120556 A1 25-11-2009
			JP 2010513346 T 30-04-2010
			KR 20090101903 A 29-09-2009
			US 2010056639 A1 04-03-2010
WO 2007128410	A	15-11-2007	EP 2016067 A1 21-01-2009
			JP 2009535311 T 01-10-2009
			US 2009192175 A1 30-07-2009
WO 0027823	A1	18-05-2000	AT 299499 T 15-07-2005
			AU 1061500 A 29-05-2000
			BR 9915194 A 07-08-2001
			CA 2346108 A1 18-05-2000
			CN 1325385 A 05-12-2001
			DE 69926148 D1 18-08-2005
			EP 1178969 A1 13-02-2002
			HU 0104038 A2 29-05-2002
			JP 2002529455 T 10-09-2002
			NO 20012288 A 02-07-2001
			PL 347591 A1 08-04-2002
			US 6479531 B1 12-11-2002
			EP 1911751
AU 2006260299 A1 28-12-2006			
CA 2612976 A1 28-12-2006			
CN 101203484 A 18-06-2008			
WO 2006137376 A1 28-12-2006			
KR 20080016961 A 22-02-2008			
KR 20090130887 A 24-12-2009			
NZ 565245 A 30-07-2010			
US 2009233962 A1 17-09-2009			
ZA 200800608 A 24-06-2009			