

(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  
30. September 2010 (30.09.2010)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2010/108611 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation:

A01N 43/54 (2006.01) C07D 239/42 (2006.01)  
C07D 239/30 (2006.01) A01P 13/00 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2010/001600

(22) Internationales Anmeldedatum:

13. März 2010 (13.03.2010)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

09004084.1 21. März 2009 (21.03.2009) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BAYER CROPSCIENCE AG** [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE). **BRÜNJES, Marco** [DE/DE]; Am Stegskreuz 3b, 65719 Hofheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **DIETRICH, Hansjörg** [DE/DE]; Bonifatiusstr. 1b, 65835 Liederbach am Taunus (DE). **AHRENS, Hartmut** [DE/DE]; Auf der Höhe 14, 63329 Egelsbach (DE). **HOFFMANN, Michael, Gerhard** [DE/DE]; Jahnstr. 6a, 65439 Flörsheim (DE). **DITTGEN, Jan** [DE/DE]; Burgstrasse 26, 60316 Frankfurt (DE). **FEUCHT, Dieter** [DE/DE]; Am Burggraben 7a, 65760 Eschborn (DE). **ROSINGER, Christopher, Hugh** [GB/DE]; Am Hochfeld 33, 65719 Hofheim (DE). **HÄUSER-HAHN, Isolde** [DE/DE]; Dünfelder Str. 22, 51375 Leverkusen (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER CROPSCIENCE AG**; Patents and Licensing, Industriepark Hoechst, Building K 801, 65926 Frankfurt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

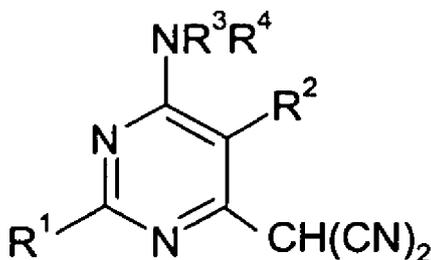
(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE,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

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eingehen (Regel 48 Absatz 2 Buchstabe h)

(54) Title: PYRIMINDINE-4-YLPROPANE DINITRILE DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF, AND USE THEREOF AS HERBICIDE AND PLANT GROWTH REGULATORS

(54) Bezeichnung : PYRIMIDIN-4-YLPROPANDINITRIL - DERIVATE, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG SOWIE DEREN VERWENDUNG ALS HERBIZIDE UND PFLANZENWACHSTUMSREGULATOREN



(57) Abstract: The invention relates to compounds of the formula (I) and the N-oxides, tautomers, and agrochemically compatible salts thereof. The invention further relates to a method for the production thereof, and to the use thereof as herbicide and plant growth regulators, particularly as a herbicide for selectively treating weeds in commercial plant cultures.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Verbindungen der Formel (I) und deren N-Oxide, Tautomere und agrochemisch verträglichen Salze. Verfahren zu deren Herstellung, sowie deren Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren, insbesondere als Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Schädipflanzen in Nutzpflanzenkulturen.

WO 2010/108611 A1

- 5 Pyrimidin-4-ylpropandinitril-Derivate, Verfahren zu deren Herstellung sowie deren Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren

Die vorliegende Erfindung betrifft neue, herbizid wirksame Pyrimidin-4-ylpropandinitril-Derivate sowie Verfahren zu deren Herstellung. Weiterer

- 10 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist deren Verwendung als Herbizid, insbesondere als Herbizid zur selektiven Bekämpfung von Schadpflanzen in Nutzpflanzenkulturen, und als Pflanzenwachstumsregulator allein oder in Kombination mit Safenern und/oder in Mischung mit anderen Herbiziden.

- 15 Aus verschiedenen Schriften ist bekannt, dass substituierte Pyrimidin-Derivate herbizide bzw. schädlingsbekämpfende Eigenschaften besitzen (siehe beispielsweise WO 2005/063721, WO 2007/082076, sowie C. Lamberth, Heterocycles 2006, 68, 3, 561-603 und dort zitierte Literatur). Die aus den oben genannten Schriften bekannten Wirkstoffe weisen bei ihrer Anwendung jedoch
- 20 Nachteile auf, z. B. dass sie (a) keine oder aber eine nur unzureichende herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen, (b) ein zu geringes Spektrum der bekämpften Schadpflanzen, oder (c) eine zu geringe Selektivität in Nutzpflanzenkulturen besitzen.

- 25 Aus EP 0 136 976 A bekannt sind 2-Phenyl-substituierte Pyrimidine, welche als Wachstumsregulatoren eingesetzt werden. Eine herbizide Wirkung wird jedoch nicht offenbart, ebensowenig wie das erfindungsgemäße Substitutionsmuster.

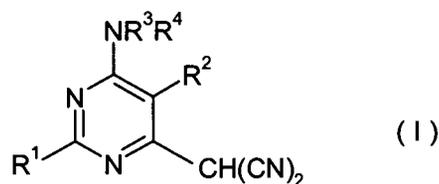
DE 25 20 381 A1 offenbart ebenfalls Pyrimidin-basierte

- 30 Pflanzenwachstumsregulatoren, welche allerdings nur aliphatische Kohlenwasserstoff-Substituenten am Pyrimidin tragen.

Es ist deshalb wünschenswert, chemische Wirkstoffe bereitzustellen, die mit Vorteilen als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden

können.

Es wurde nun überraschend gefunden, dass bestimmte substituierte Pyrimidin-4-ypropandinitril-Derivate gute herbizide Wirkung und gleichzeitig hohe Verträglichkeit gegenüber Nutzpflanzen aufweisen. Ein Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel (I) und deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze,



10

worin die Reste die folgende Bedeutung aufweisen:

R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Hydroxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkinyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkinyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylsulfinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenylsulfinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxycarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Trialkylsilyl, Phenyl, Phenoxy oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Ring, jeder Phenyl-Ring, Phenoxy-Ring oder 5- oder 6-gliedrige heteroaromatische Ring optional substituiert mit 1-3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus R<sup>28</sup>; oder zwei

benachbarte Reste  $R^x$  bilden gemeinsam eine Gruppe

-OCH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH(CH<sub>3</sub>)O-, -OC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>O-, -OCF<sub>2</sub>O-,  
-CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O- oder -CH=CH-CH=CH-; oder

- 5 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten  $R^y$ , welche unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Aryl bedeuten; oder
- 10 (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten  $R^z$ , welche unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio bedeuten;
- 15  $R^2$  ist H, F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, OR<sup>5</sup>, SR<sup>6</sup> oder N(R<sup>7</sup>)R<sup>8</sup>; worin R<sup>5</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl ist, R<sup>6</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl ist und R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> unabhängig voneinander H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl sind;
- 20  $R^3$  ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl optional substituiert mit 1-2 Resten  $R^9$ , (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl optional substituiert mit 1-2 Resten  $R^{10}$ , oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkinyl optional substituiert mit 1-2 Resten  $R^{11}$ ; oder  $R^3$  ist C(=O)R<sup>12</sup>, NO<sub>2</sub>, OR<sup>13</sup>, S(O)<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, N(R<sup>15</sup>)R<sup>16</sup> oder N=C(R<sup>17</sup>)R<sup>18</sup>;
- 25  $R^4$  ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl optional substituiert mit 1-2 Resten  $R^9$ , oder C(=O)R<sup>12</sup>; oder  $R^3$  und  $R^4$  bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, jede Gruppe optional substituiert mit 1-2 Resten  $R^{19}$ ; oder  $R^3$  und  $R^4$  bilden gemeinsam eine Gruppe =C(R<sup>20</sup>)N(R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup> oder =C(R<sup>23</sup>)OR<sup>24</sup>;
- dabei ist jeder Rest  $R^9$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkylthio, Amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Dialkylamino oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl;
- 30  $R^{12}$  ist jeweils unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyl-oxy;
- $R^{13}$  ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup>;

- R<sup>14</sup> ist (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl;
- R<sup>15</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder C(=O)R<sup>27</sup>;
- R<sup>16</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;
- R<sup>17</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder Phenyl optional substituiert mit 1-3 Resten, welche  
 5 voneinander unabhängig CH<sub>3</sub>, Cl oder OCH<sub>3</sub> bedeuten;
- R<sup>18</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-;
- R<sup>19</sup> ist jeweils unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy,  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkylthio, Amino, (C<sub>1</sub>-  
 10 C<sub>3</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Dialkylamino oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl;
- R<sup>20</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;
- R<sup>21</sup> und R<sup>22</sup> sind unabhängig voneinander H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>21</sup> und R<sup>22</sup>  
 bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>- oder  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-;
- 15 R<sup>23</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;
- R<sup>24</sup> ist (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;
- R<sup>25</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder  
 Benzyloxy;
- R<sup>26</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy;
- 20 R<sup>27</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) Alkyl oder Benzyl; und
- R<sup>28</sup> ist jeweils unabhängig voneinander Halogen, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Alkinyl, (C<sub>3</sub>-  
 C<sub>4</sub>)Haloalkinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-  
 C<sub>4</sub>)Haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylamino,  
 25 (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy-carbonyl, (C<sub>2</sub>-  
 C<sub>6</sub>)Alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylaminocarbonyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Trialkylsilyl.

Dabei ist bei den genannten Resten stets die Gesamtzahl an C-Atomen angegeben,  
 z.B. ist ein Dimethylaminocarbonyl-Rest ein C<sub>3</sub>-Rest.

30

Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin die Reste folgende Bedeutung  
 aufweisen:

R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, -OCH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH(CH<sub>3</sub>)O-, -OC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>O-, -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O- oder -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, wobei die acht letztgenannten Substituenten jeweils durch zwei benachbarte R<sup>x</sup> gebildet werden; oder

10

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl; oder

15

(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio;

20 R<sup>2</sup> ist H, F, Cl, Br, I, CN oder NO<sub>2</sub>;

R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, C(=O)R<sup>12</sup>, OR<sup>13</sup>, N(R<sup>15</sup>)R<sup>16</sup> oder N=C(R<sup>17</sup>)R<sup>18</sup>;

25 R<sup>4</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>9</sup>, oder C(=O)R<sup>12</sup>; oder

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder =C(R<sup>20</sup>)N(R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>;

30 dabei ist jeder Rest R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkylthio, Amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Dialkylamino oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl;

R<sup>12</sup> ist jeweils unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy;

R<sup>13</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup>;

R<sup>15</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder C(=O)R<sup>27</sup>;

R<sup>16</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

5 R<sup>17</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder Phenyl optional substituiert mit 1-3 Resten, welche voneinander unabhängig CH<sub>3</sub>, Cl oder OCH<sub>3</sub> bedeuten;

R<sup>18</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-;

R<sup>20</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

10 R<sup>21</sup> und R<sup>22</sup> sind unabhängig voneinander H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>21</sup> and R<sup>22</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-;

R<sup>25</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy; und

15 R<sup>26</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin die Reste folgende Bedeutung aufweisen:

- R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, -OCH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O- oder -OCH(CH<sub>3</sub>)O-, wobei die drei letztgenannten Substituenten jeweils durch zwei benachbarte R<sup>x</sup> gebildet werden; oder
- 20 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy oder unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogene substituiertes Phenyl; oder
- 25 (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy;
- 30 R<sup>2</sup> ist F, Cl, Br, I oder NO<sub>2</sub>;

R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, C(=O)R<sup>12</sup>, worin R<sup>12</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy ist, oder OR<sup>13</sup>, worin R<sup>13</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup> ist, worin R<sup>25</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy ist, und R<sup>26</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy ist;

R<sup>4</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin die Reste folgende Bedeutung aufweisen:

R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy; oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy oder unsubstituiertes oder durch ein Halogen substituiertes Phenyl; oder (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy;

R<sup>2</sup> ist F, Cl, Br, I oder NO<sub>2</sub>;

R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, C(=O)R<sup>12</sup>, worin R<sup>12</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy ist, oder OR<sup>13</sup>, worin R<sup>13</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl ist; und

R<sup>4</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin die Reste folgende Bedeutung aufweisen:

R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy; oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Phenyl oder 4-Halogen-Phenyl;



chromatographische Trennverfahren, isolieren. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft somit auch alle Stereoisomeren, die von der allgemeinen Formel (I) umfasst werden, auch wenn sie  
5 nicht mit ihrer spezifischen Stereoform angegeben sind, und deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel (I) können agrochemisch geeignete Salze bilden. Salzbildung kann in bekannter Weise, z. B. durch Einwirkung einer Base auf solche Verbindungen der Formel (I) erfolgen, die ein acides Wasserstoffatom tragen, z.B.  
10 im Falle dass R<sup>1</sup> eine OH-Gruppe oder eine Sulfonamid-Gruppe -NHSO<sub>2</sub>- enthält. Eine Salzbildung kann ebenfalls durch das Einwirken einer Base auf CH-acide Verbindungen, wie (substituierte) Propandinitrile, erfolgen. Geeignete Basen sind beispielsweise organische Amine, wie Trialkylamine, Morpholin, Piperidin oder Pyridin sowie Ammoniak, Ammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide,  
15 -carbonate und -hydrogencarbonate, insbesondere Natrium- und Kaliumhydroxid, Natrium- und Kaliumcarbonat und Natrium- und Kaliumhydrogencarbonat. Diese Salze sind Verbindungen, in denen der acide Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird, beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium-  
20 und Kaliumsalze, oder auch Salze mit organischen Aminen oder Ammoniumsalze, zum Beispiel mit Ammoniumionen der Formel [NRR'R''R''']<sup>+</sup>, worin R, R', R'' und R''' jeweils unabhängig voneinander H oder einen organischen Rest, insbesondere (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)Aryl, (C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>)Aralkyl oder (C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>)Alkylaryl darstellen. Beispiele sind [NH<sub>4</sub>]<sup>+</sup>, [NH<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>]<sup>+</sup>, [NH<sub>2</sub>(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]<sup>+</sup>, [NH(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]<sup>+</sup>, [N(CH<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]<sup>+</sup>, [NH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]<sup>+</sup> oder  
25 [NH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>]<sup>+</sup>. In Frage kommen auch Alkylsulfonium- und Alkylsulfoxoniumsalze, wie (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Trialkylsulfonium- und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Trialkylsulfoxoniumsalze.

Die Verbindungen der Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, beispielsweise Mineralsäuren, wie  
30 beispielsweise HCl, HBr, H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> oder HNO<sub>3</sub>, oder organische Säuren, z. B. Carbonsäuren, wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Milchsäure oder Salicylsäure, oder Sulfonsäuren, wie zum Beispiel p-Toluolsulfonsäure, an eine

basische Gruppe, wie Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Piperidino, Morpholino oder Pyridino, Salze bilden. Diese Salze enthalten dann die konjugierte Base der Säure als Anion. Geeignete Substituenten, die in deprotonierter Form, wie z.B. Sulfonsäuren, Carbonsäuren oder CH-acide Gruppen, wie Propandinitrile, vorliegen, können auch innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie Aminogruppen, bilden.

Die Verbindungen der Formel (I) können N-Oxide bilden. Die N-Oxide können in bekannter Weise z. B. durch Oxidation der jeweiligen Pyrimidine mit Peroxycarbonsäuren oder Wasserstoffperoxid in Lösungsmitteln wie Acetonitril, Dichlormethan, Chloroform, Aceton, DMF, Essigsäure, z. B. bei Temperaturen zwischen 0° und 100°C gebildet werden (siehe: S. von Angerer, Science of Synthesis 2003, 16, 548-550 und die jeweils darin zitierte Literatur).

Die Verbindungen der Formel (I) und deren N-Oxide und agrochemisch geeigneten Salze werden auch kurz als erfindungsgemäß verwendete oder erfindungsgemäße Verbindungen bezeichnet. Die vorstehend und weiter unten verwendeten Bezeichnungen sind dem Fachmann geläufig und haben insbesondere die im Folgenden erläuterten Bedeutungen:

Ein anorganischer Rest ist ein Rest ohne Kohlenstoffatome, vorzugsweise Halogen, OH und dessen anorganische Salze, bei denen das H durch ein Kation, beispielsweise Alkalimetall- und Erdalkalimetallsalze ersetzt wird, -NH<sub>2</sub> und dessen Ammoniumsalze mit (anorganischen) Säuren, beispielsweise Mineralsäuren, -N<sub>3</sub> (Azid), -N<sub>2</sub><sup>+</sup>A<sup>-</sup> (Diazonium-Gruppe, wobei A<sup>-</sup> ein Anion darstellt), -NO, -NHOH, -NHNH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -ONO, -ONO<sub>2</sub>, -SH, -SOH (Sulfensäure-Gruppe), -S(O)OH (Sulfinsäure-Gruppe), -S(O)<sub>2</sub>OH (oder auch kurz SO<sub>3</sub>H, Sulfonsäure-Gruppe), -O-SO<sub>2</sub>H (Sulfit-Gruppe), -O-SO<sub>3</sub>H (Sulfat-Gruppe), -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> (Sulfamoyl-Gruppe), -SO<sub>2</sub>NHOH (Hydroxysulfamoyl-Gruppe), -NHS(O)OH (Sulfinoamino-Gruppe), -NHS(O)<sub>2</sub>OH (Sulfoamino-Gruppe), -P(O)(OH)<sub>2</sub> (Phosphonsäure-Gruppe), -O-P(OH)<sub>3</sub> (Phosphat-Gruppe), -P(O)(NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>, -PO(OH)(NH<sub>2</sub>), -PS(OH)<sub>2</sub>, -PS(NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> oder -PS(OH)(NH<sub>2</sub>), -B(OH)<sub>2</sub> (Boronsäure-Gruppe) und die hydratisierten oder

- dehydratisierten Formen der Säuregruppen sowie deren (anorganischen) Salze; der Begriff "anorganischer Rest" umfasst auch den Wasserstoffrest (das Wasserstoffatom), wobei dieser in den Definitionen oft bereits Bestandteil des unsubstituierten Grundkörpers eines organischen Restes ist (Beispiel
- 5 "unsubstituiertes Phenyl");
- der Begriff "anorganischer Rest" umfasst hier vorzugsweise nicht Pseudohalogen-Gruppen wie CN, SCN, organische Metallkomplexe, Carbonat oder COOH, die wegen des Gehalts an C-Atomen den organischen Resten zugeordnet werden.
- 10 Die Bezeichnung "Halogen" oder „Halogenatom“ bedeutet beispielsweise Fluor, Chlor, Brom oder Iod.
- Wird die Bezeichnung für einen Rest verwendet, dann bedeutet "Halogen" oder „Halogenatom“ beispielsweise ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Iodat.
- 15 Alkyl bedeutet einen geradkettigen, verzweigten oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest. Der Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl" bedeutet beispielsweise eine Kurzschreibweise für Alkyl mit einem bis 4 Kohlenstoffatomen entsprechend der Bereichsangabe für C-Atome und umfasst z.B. die Reste Methyl, Ethyl, 1-Propyl, 2-Propyl, 1-Butyl, 2-Butyl, 2-Methylpropyl, tert-Butyl, Cyclopropyl und Cyclobutyl.
- 20 Allgemeine Alkylreste mit einem größeren angegebenen Bereich von C-Atomen, z. B. "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl", umfassen entsprechend auch gradkettige, verzweigte oder cyclische Alkylreste mit einer größeren Zahl von C-Atomen, d. h. gemäß Beispiel auch die Alkylreste mit 5 und 6 C-Atomen.
- Wenn nicht speziell angegeben, sind bei den Kohlenwasserstoffresten wie Alkyl-,
- 25 Alkenyl- und Alkinyresten, auch in zusammengesetzten Resten, die niederen Kohlenstoffgerüste, z.B. mit 1 bis 6 C-Atomen bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 C-Atomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Resten wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, Cyclo-, n- oder i-Propyl, Cyclo-, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie Cyclohexyl, n-Hexyl, i-Hexyl und
- 30 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie Cycloheptyl, n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl.

- Bevorzugte cyclische Alkylreste weisen vorzugsweise 3-8 Ring-C-Atome auf, z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl. Im Falle von gegebenenfalls substituierten cyclischen Alkylresten werden cyclische Systeme mit Substituenten umfasst, wobei auch Substituenten mit einer Doppelbindung am cyclischen Alkylrest, z. B. eine Alkylidengruppe wie Methyliden, umfasst sind.
- Im Falle von gegebenenfalls substituierten cyclischen Alkylresten werden auch mehrcyclische aliphatische Systeme umfasst, wie Bicyclo[1.1.0]butan-1-yl, Bicyclo[1.1.0]butan-2-yl, Bicyclo[2.1.0]pentan-1-yl, Bicyclo[2.1.0]pentan-2-yl, Bicyclo[2.1.0]pentan-5-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl (Norboryl), Adamantan-1-yl und Adamantan-2-yl.
- Im Falle von gegebenenfalls substituierten cyclischen Alkylresten werden auch spirocyclische aliphatische Systeme umfasst, wie beispielsweise Spiro[2.2]pent-1-yl, Spiro[2.3]hex-1-yl, Spiro[2.3]hex-4-yl, 3-Spiro[2.3]hex-5-yl.
- Alkenyl- und Alkynylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten geradkettigen, verzweigten oder cyclischen Reste, wobei mindestens eine Doppelbindung bzw. Dreifachbindung enthalten ist. Bevorzugt sind Reste mit einer Doppelbindung bzw. mit einer Dreifachbindung.
- Alkenyl schließt auch geradkettige, verzweigte oder cyclische Kohlenwasserstoffreste mit mehr als einer Doppelbindung ein, wie 1,3-Butadienyl, 1,4-Pentadienyl oder Cyclohexadienyl, aber auch Allenyl- oder Kumulenyl-reste mit einer bzw. mehreren kumulierten Doppelbindungen, wie beispielsweise Allenyl (1,2-Propadienyl), 1,2-Butadienyl und 1,2,3-Pentatrienyl.
- Alkynyl schließt auch geradkettige, verzweigte oder cyclische Kohlenwasserstoffreste mit mehr als einer Dreifachbindung oder auch mit einer oder mehreren Dreifachbindungen und einer oder mehreren Doppelbindungen ein, wie beispielsweise 1,3-Butatrienyl bzw. 3-Penten-1-in-1-yl.
- Alkenyl bedeutet z.B. Vinyl, welches ggf. durch weitere Alkylreste substituiert sein kann, z.B. Prop-1-en-1-yl, But-1-en-1-yl;
- Allyl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl und 1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methylprop-1-en-1-yl, 1-Methylprop-1-en-1-yl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl,

But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl oder 1-Methyl-but-2-en-1-yl, Pentenyl, 2-Methylpentenyl oder Hexenyl.

(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl bedeutet beispielsweise Ethinyl, Propargyl, 1-Methyl-prop-2-in-1-yl, 2-Butinyl, 2-Pentinyl oder 2-Hexinyl, vorzugsweise Propargyl, But-2-in-1-yl,

5 But-3-in-1-yl oder 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Cyclische Alkenylreste bedeuten ein carbocyclisches, nicht aromatisches, partiell ungesättigtes Ringsystem mit vorzugsweise 4-8 C-Atomen, z.B. 1-Cyclobutenyl, 2-Cyclobutenyl, 1-Cyclopentenyl, 2-Cyclopentenyl, 3-Cyclopentenyl, oder  
10 1-Cyclohexenyl, 2-Cyclohexenyl, 3-Cyclohexenyl, 1,3-Cyclohexadienyl oder 1,4-Cyclohexadienyl, wobei auch Substituenten mit einer Doppelbindung am Cycloalkenylrest, z. B. eine Alkylidengruppe wie Methyliden, umfasst sind. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Cycloalkenyl gelten die Erläuterungen für substituierte cyclische Alkylreste entsprechend.

15

Alkyliden, z. B. auch in der Form (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)Alkyliden, bedeutet den Rest eines geradkettigen, verzweigten oder cyclischen Kohlenwasserstoffrests, der über eine Zweifachbindung gebunden ist. Als Bindungsstelle für Alkyliden kommen naturgemäß nur Positionen am Grundkörper in Frage, an denen zwei H-Atome durch  
20 die Doppelbindung ersetzt werden können; Reste sind z. B. =CH<sub>2</sub>, =CH-CH<sub>3</sub>, =C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>3</sub>, =C(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> oder =C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>.

Aryl bedeutet ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System mit vorzugsweise 6 bis 14, insbesondere 6 bis 10 Ring-C-Atomen, beispielsweise  
25 Phenyl, Naphthyl, Anthryl, Phenanthrenyl, und ähnliches, vorzugsweise Phenyl.

Im Falle gegebenenfalls substituierten Aryls sind auch mehrcyclische Systeme, wie Tetrahydronaphtyl, Indenyl, Indanyl, Fluorenyl, Biphenyl, umfasst, wobei die Bindungsstelle am aromatischen System ist. Von der Systematik her ist Aryl in der  
30 Regel auch von dem Begriff „gegebenenfalls substituiertes Phenyl“ umfasst.

Mit der Definition „mit einem oder mehreren Resten substituiert ist“ sind, wenn nicht

anders definiert, unabhängig voneinander ein oder mehrere gleiche oder verschiedene Reste gemeint, wobei zwei oder mehrere Reste an einem Cyclus als Grundkörper einen oder mehrere Ringe bilden können.

- Substituierte Reste, wie ein substituierter Alkyl-, Alkenyl-, Alkynyl-, Aryl-, Phenyl-, Benzyl-, Heterocyclyl- 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 Dialkylaminocarbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Trialkylsilyl und gegebenenfalls substituiertes cyclisches Alkyl, 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 Dialkyl-aminoalkyl und Hydroxy-alkyl bedeuten;
- im Begriff "substituierte Reste" wie substituiertes Alkyl (z.B. gradkettiges, verzweigtes oder cyclisches Alkyl) etc. sind als Substituenten zusätzlich zu den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische und aromatische Reste, wie gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkenylthio, Alkynylthio, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkynylcarbonyl, Mono- und Dialkenylaminocarbonyl, Mono- und Dialkynylaminocarbonyl, Mono- und Dialkenylamino, Mono- und Dialkynylamino, Trialkenylsilyl, Trialkynylsilyl, 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 oder substituierten Iminogruppe substituiert sind.

Wenn zwei oder mehrere Reste einen oder mehrere Ringe bilden, so können diese carbocyclisch, heterocyclisch, gesättigt, teilgesättigt, ungesättigt, beispielsweise auch aromatisch und gegebenenfalls weiter substituiert sein. Die annellierten Ringe  
5 sind vorzugsweise 5- oder 6-Ringe, besonders bevorzugt sind benzokondensierte Cyclen.

Die beispielhaft genannten Substituenten ("erste Substituentenebene") können, sofern sie kohlenwasserstoffhaltige Anteile enthalten, dort gegebenenfalls weiter  
10 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.

15 Bevorzugte Substituenten für die Substituentenebenen sind beispielsweise Amino, Hydroxy, Halogen, Nitro, Cyano, Isocyano, Mercapto, Isothiocyanato, Carboxy, Carbonamid, SF<sub>5</sub>, Aminosulfonyl, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Monoalkyl-amino, Dialkyl-amino, N-Alkanoyl-amino, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxy-carbonyl, Alkinyloxy-carbonyl, Aryloxy-carbonyl, Alkanoyl, Alkenyl-  
20 carbonyl, Alkinyl-carbonyl, Aryl-carbonyl, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Alkylsulfenyl, Alkylsulfinyl, wobei beide Enantiomere der Alkylsulfinylgruppe umfasst sind, Alkylsulfonyl, Monoalkyl-aminosulfonyl, Dialkyl-aminosulfonyl, Alkylphosphinyl, Alkylphosphonyl, wobei für Alkylphosphinyl bzw. Alkylphosphonyl beide Enantiomere umfasst sind, N-Alkyl-aminocarbonyl, N,N-Dialkyl-aminocarbonyl, N-Alkanoyl-amino-  
25 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 beispielsweise Alkoxyalkyl, wie Monoalkoxyalkyl oder Dialkoxyalkyl,  
30 Alkylthioalkyl, Alkylthioalkoxy, Alkoxyalkoxy, wie Monoalkoxyalkoxy oder Dialkoxyalkoxy, Benzyl, Phenethyl, Benzyloxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Haloalkylthio, Haloalkanoyl, Haloalkylcarbonyl, Haloalkoxycarbonyl, Haloalkoxyalkoxy,

Haloalkoxyalkylthio, Haloalkoxyalkanoyl, Haloalkoxyalkyl, Alkanoylalkyl, Haloalkanoylalkyl, Alkanoyloxyalkyl.

Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 6 C-Atomen, vorzugsweise 1 bis  
5 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, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl,  
vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl,  
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, Nitro und  
Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy, Fluor  
10 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,  
15 Alkoxy, Acyl und Aryl N-substituiert sind; vorzugsweise Mono- und Dialkyl-amino,  
Mono- und 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  
20 genannte Definition, vorzugsweise (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkanoyl. Entsprechendes gilt für  
substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

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

25 Eine der Carboxygruppe äquivalente Gruppe bedeutet beispielsweise ein Alkylester,  
Arylester, O-Alkylthioester, S-Alkyldithioester, S-Alkylthioester, Carboximidester,  
Carboximidthioester; 5,6-Dihydro-1,2,4-dioxazin-3-yl; 5,6-Dihydro-1,2,4-oxathiazin-3-  
yl, Trialkylorthoester, Dialkoxyalkylaminoester, Dialkylaminoalkoxyester,  
Trialkylaminoester, Amidine, Dialkoxyketenacetale oder Dialkyldithioketenacetale.

30

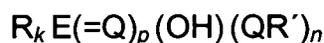
Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert  
oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder

verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)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 Heterocyclyl ist vorzugsweise Heterocyclyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkoxy, Nitro und Oxo substituiert ist, insbesondere ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl und Oxo, ganz besonders durch einen oder zwei (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylreste substituiert ist.

Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch gleiche oder verschiedene Halogenatome, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl) wie CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, CHClCH<sub>3</sub>, CHFCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F; Perhaloalkyl wie CCl<sub>3</sub> oder CF<sub>3</sub> oder CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>; Polyhaloalkyl wie CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CH<sub>2</sub>CHFCl, CHCl<sub>2</sub>, CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>; Haloalkoxy ist z.B. OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>F, OCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl; Entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierten Reste.

Ein organischer Säurerest bedeutet einen Rest einer Oxosäure oder Thiosäure der allgemeinen Formel



30

wobei

R ein organischer Rest,

E ein Atom aus der Gruppe C, S, P,

Q unabhängig voneinander ein Atom oder ein Molekülfragment aus der Gruppe O, S, NR' und

R' unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, Alkyl, Haloalkyl, Alkoxyalkyl oder gegebenenfalls Aryl bedeutet.

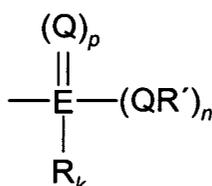
5

$k, p$  sind natürliche Zahlen,  $k = 1, 2$ ;  $p = 0 - 2$ ;

$n$  ist eine natürliche Zahl oder Null.

Der organische Säurerest entsteht formal durch Abtrennen einer Hydroxygruppe an der Säurefunktion, wobei der organische Rest R in der Säure auch über ein oder

10 mehrere Heteroatome mit der Säurefunktion verbunden sein kann:



Für Oxosäuren des Kohlenstoffs ist dies im IUPAC Compendium of Chemical Terminology (1997) beschrieben.

15

Beispiele für organische Säurereste, die von den Oxosäuren bzw. Thiosäuren des Schwefels abgeleitet sind ( $E = S$ ), sind  $\text{S}(\text{O})\text{OCH}_3$ ,  $\text{SO}_2\text{OH}$ ,  $\text{SO}_2\text{OCH}_3$  oder  $\text{SO}_2\text{NHR}$  (N-substituierte Sulfonamidsäuren).

Im Falle von  $k = 1$  sind auch Alkylsulfonyl- und Alkylsulfinyl-Reste, wie z.B.

20  $(\text{H}_3\text{C})\text{S}(\text{O})_2$ ,  $(\text{F}_3\text{C})\text{S}(\text{O})_2$ , *p*-TolylS(O)<sub>2</sub>,  $(\text{H}_3\text{C})\text{S}(\text{O})(\text{NH}-n\text{-C}_4\text{H}_9)$ ,  $(\text{C}_6\text{H}_5)\text{S}(\text{S})(\text{O})$  oder  $(\text{C}_6\text{H}_5)\text{S}(\text{O})$  mit umfasst.

Beispiele für organische Säurereste, die von den Oxosäuren bzw. Thiosäuren des Phosphors abgeleitet sind ( $E = P$ ), sind von der Phosphinsäure und der

Phosphonsäure abgeleitete Reste, wobei diese Reste weiter verestert sein können,

25 z.B.  $-\text{PO}(\text{OCH}_3)_2$ ,  $(\text{C}_2\text{H}_5\text{O})\text{P}(\text{O})\text{OH}$ ,  $(\text{C}_2\text{H}_5\text{O})\text{P}(\text{O})(\text{SC}_6\text{H}_5)$ ,  $(\text{H}_3\text{CO})\text{P}(\text{O})\text{NH}(\text{C}_6\text{H}_5)$  oder  $-\text{PO}(\text{NMe}_2)_2$ .

Im Falle von  $k = 1$  sind auch Alkylphosphinyl- und Alkylphosphonyl-Reste, wie z.B.

$(\text{H}_3\text{C})_2\text{P}(\text{O})$ ,  $(\text{C}_6\text{H}_5)_2\text{P}(\text{O})$ ,  $(\text{H}_3\text{C})(\text{C}_6\text{H}_5)\text{P}(\text{O})$ ;  $(\text{H}_3\text{C})\text{P}(\text{O})\text{OCH}_3$ ,  $(\text{H}_5\text{C}_2)\text{P}(\text{O})(\text{OC}_2\text{H}_5)$ ,  $(\text{C}_6\text{H}_5)\text{P}(\text{O})(\text{OC}_2\text{H}_5)$ ,  $(\text{C}_2\text{H}_5)\text{P}(\text{O})(\text{SC}_6\text{H}_5)$ ,  $(\text{H}_3\text{C})\text{P}(\text{O})\text{NH}(\text{C}_6\text{H}_5)$ ,  $(\text{H}_3\text{C})\text{P}(\text{S})(\text{NH}-i\text{-C}_3\text{H}_7)$ ,

$(C_6H_5)P(S)(OC_2H_5)$  oder  $(C_6H_5)P(S)(SC_2H_5)$  mit umfasst.

Organische Säurereste, die von den Oxosäuren des Kohlenstoffs abgeleitet sind (E = C, Q = O), werden im engeren Sinne auch mit dem Begriff „Acyl“ bezeichnet.

5

Beispiele für Acyl sind der Rest -CO-R einer Carbonsäure HO-CO-R und Reste davon abgeleiteter Säuren oder der Rest von Kohlensäuremonoestern oder N-substituierter Carbaminsäuren sowie Carbonate und deren Ester.

10 Acyl bedeutet beispielsweise Formyl, Oxalyl(ester), Alkylcarbonyl wie [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl]-carbonyl, Haloalkylcarbonyl, Phenylcarbonyl, Alkyloxycarbonyl, speziell tert.-Butyloxycarbonyl, Phenylloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Fluorenyloxycarbonyl, N-Alkyl-1-iminoalkyl, N-Alkyl- und N,N-Dialkylcarbamoyl. Dabei können die Reste jeweils im Alkyl- oder Phenylteil noch weiter substituiert  
15 sein, beispielsweise im Alkylteil durch ein oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Alkoxy, Phenyl und Phenoxy; Beispiele für Substituenten im Phenylteil sind die bereits weiter oben allgemein für substituiertes Phenyl erwähnten Substituenten.

20 Acyl bedeutet vorzugsweise einen Acylrest im engeren Sinne, d.h. einen Rest einer organischen Säure, bei der die Säuregruppe direkt mit dem C-Atom eines organischen Restes verbunden ist, beispielsweise Alkanoyl, wie Formyl und Acetyl, Aroyl wie Phenylcarbonyl, und andere Reste von gesättigten oder ungesättigten organischen Säuren.

25

"Aroyl" bedeutet einen wie vorstehend definierter Arylrest, der über eine Carbonyl-Gruppe gebunden ist, z.B. die Benzoyl-Gruppe.

Wenn ein allgemeiner Rest mit "Wasserstoff" definiert ist, bedeutet dies ein  
30 Wasserstoffatom.

Mit "yl-Position" eines Restes ist dessen Bindungsstelle bezeichnet.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Methoden zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen. Die erfindungsgemäßen Verbindungen können alternativ durch verschiedene Verfahren dargestellt werden.

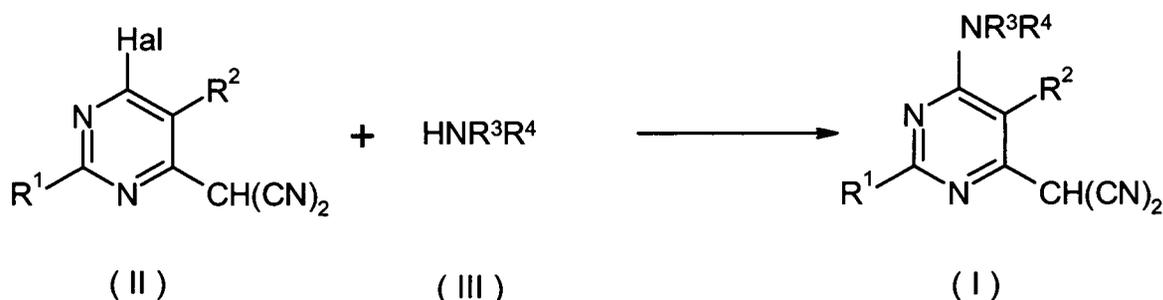
5

In den nachfolgenden Verfahren werden partiell Lösemittel verwendet. In diesem Zusammenhang bezeichnen „inerte Lösemittel“ jeweils Lösemittel, die unter den jeweiligen Reaktionsbedingungen inert sind, jedoch nicht unter beliebigen Reaktionsbedingungen inert sein müssen.

10

Verbindungen der Formel (I) können z. B. durch Reaktion der entsprechenden Halogenverbindungen (II) mit dem jeweiligen Amin der Formel (III) hergestellt werden, optional unter Verwendung einer organischen oder anorganischen Base (z. B. Triethylamin, Pyridin, Kaliumcarbonat, Natriumcarbonat). Die Reaktion kann in verschiedenen Lösungsmitteln wie Methanol, Ethanol, Dioxan, THF, Dichlormethan, DMSO, DMF und Wasser durchgeführt werden. Die Reaktionstemperaturen liegen je nach verwendetem Amin im Allgemeinen zwischen 20°C und 180°C.

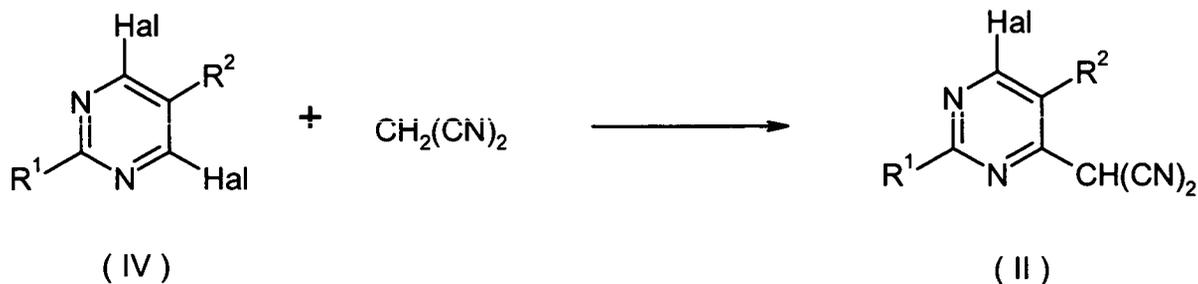
15



20

Verbindungen der Formel (II) können z. B. durch Reaktion der entsprechenden 4,6-Dihalogenverbindungen (IV) mit dem jeweiligen Alkalisalz des Malondinitrils erhalten werden. Die jeweiligen Salze können z. B. in situ durch Behandlung von Malondinitril mit verschiedenen Basen wie z.B. n-Butyllithium, Lithiumdiisopropylamid, Natriumhydrid oder Kaliumcarbonat bei Temperaturen zwischen -80°C und 80°C generiert werden. Nach Zugabe der 4,6-Dihalogenpyrimidine (IV) wird die Reaktion in einem Temperaturbereich zwischen 0°C und 100°C durchgeführt, bevorzugt in aprotischen Lösungsmitteln wie THF, DMSO, DMF oder Dioxan.

25



- Die Herstellung von Verbindungen der Formel (IV) erfolgt durch allgemein bekannte Methoden: K. Findeisen, K. Wagner, *Synthesis* 1978, 40-42; H. Gershon, K. Dittmer, R. Braun, *J. Org. Chem.* 1961, 26, 1874-1877; H. Gershon, R. Braun, A. Scala, R. Rodin, *J. Med. Chem.* 1964, 7, 808-811; D. T. Hurst, *Heterocycles* 1984, 22, 79-84; L. Provins et al., *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2006, 16, 1834-1839; T. Sakamoto, Y. Kondo, R. Watanabe, H. Yamanaka, *Chem. Pharm. Bull.* 1986, 34, 2719-2724; S. von Angerer, *Science of Synthesis* 2003, 16, 379-572 und die jeweils darin zitierte Literatur. In den Formeln (II), (III) und (IV) haben die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die gleiche Bedeutung wie in Formel (I), Hal in Formel (II) und (IV) bedeutet ein Halogenatom, wobei bei mehreren Hal in Formel (IV) jeweils unterschiedliche Halogene vorliegen können.
- 15 Kollektionen aus erfindungsgemäßen Verbindungen, die nach den oben genannten Reaktionen synthetisiert werden können, können auch in parallelisierter Weise hergestellt werden, wobei dies in manueller, teilweise automatisierter oder vollständig automatisierter Weise geschehen kann. Dabei ist es beispielsweise möglich, die Reaktionsdurchführung, die Aufarbeitung oder die Reinigung der Produkte bzw. Zwischenstufen zu automatisieren. Insgesamt wird hierunter eine Vorgehensweise verstanden, wie sie beispielsweise durch D. Tiebes in *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley 1999, auf den Seiten 1 bis 34 beschrieben ist.
- 25 Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, beispielsweise Calypso-Reaktionsblöcke (Calypso reaction blocks) der Firma Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA oder Reaktionsstationen (reaction stations) der

Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, England oder MultiPROBE Automated Workstations der Firma Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA. Für die parallelisierte Aufreinigung von erfindungsgemäßen Verbindungen beziehungsweise von bei der Herstellung  
5 anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise der Firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der  
10 die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den Einsatz von teilweise oder vollständig integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden. Derartige Automationssysteme können zum Beispiel von der Firma  
15 Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA bezogen werden.

Die Durchführung einzelner oder mehrerer Syntheseschritte kann durch den Einsatz von Polymer-supported reagents/Scavenger-Harze unterstützt werden. In der Fachliteratur sind eine Reihe von Versuchsprotokollen beschrieben, beispielsweise  
20 in ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

Neben den hier beschriebenen Methoden kann die Herstellung von erfindungsgemäßen Verbindungen vollständig oder partiell durch Festphasen  
25 unterstützte Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne Zwischenstufen oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepassten Synthese an ein Syntheseharz gebunden. Festphasen- unterstützte Synthesemethoden sind in der Fachliteratur hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic  
30 Press, 1998 und Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley, 1999. Die Verwendung von Festphasen-unterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten

Protokollen, die wiederum manuell oder automatisiert ausgeführt werden können. Die Reaktionen können beispielsweise mittels IRORI-Technologie in Mikroreaktoren (microreactors) der Firma Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA durchgeführt werden.

5

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

10

Die Herstellung gemäß der hier beschriebenen Verfahren liefert erfindungsgemäße Verbindungen in Form von Substanzkollektionen, die Bibliotheken genannt werden. Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Bibliotheken, die mindestens zwei erfindungsgemäße Verbindungen enthalten.

15

Die erfindungsgemäßen Verbindungen weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler annueller Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Schadpflanzen, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfasst.

20

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher auch ein Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, vorzugsweise in Pflanzenkulturen, worin eine oder mehrere erfindungsgemäße Verbindung(en) auf die Pflanzen (z.B. Schadpflanzen wie mono- oder dikotyle Unkräuter oder unerwünschte Kulturpflanzen), das Saatgut (z.B. Körner, Samen oder vegetative Vermehrungsorgane wie Knollen oder Sprosssteile mit Knospen) oder die Fläche, auf der die Pflanzen wachsen (z.B. die Anbaufläche), ausgebracht werden. Dabei können die erfindungsgemäßen Verbindungen z.B. im Vorsaats- (ggf. auch durch Einarbeitung in den Boden), Vorauf- oder Nachaufverfahren ausgebracht werden. Im Einzelnen seien beispielhaft einige

25

30

Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne dass durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

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

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

- Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran,  
25 stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

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

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Schadpflanzen aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie dikotyler Kulturen, z.B. der

5 Gattungen Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia, oder monokotyler Kulturen z.B. der Gattungen Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, insbesondere Zea und Triticum, abhängig von der

10 Struktur der jeweiligen erfindungsgemäßen Verbindung und deren Aufwandmenge nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die erfindungsgemäßen Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in Pflanzenkulturen wie landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen oder Zierpflanzungen.

15

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen (abhängig von ihrer jeweiligen Struktur und der ausgebrachten Aufwandmenge) hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten

20 Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Des Weiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große

25 Rolle, da beispielsweise die Lagerbildung hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften können die erfindungsgemäßen Verbindungen auch zur Bekämpfung von

30 Schadpflanzen in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch

Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z.B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt. Weitere besondere Eigenschaften können in einer Toleranz oder Resistenz gegen abiotische Stressoren z.B. Hitze, Kälte, Trockenheit, Salz und ultraviolette Strahlung liegen.

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

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

Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher vorkommenden Pflanzen modifizierte Eigenschaften aufweisen, bestehen beispielsweise in klassischen Züchtungsverfahren und der Erzeugung von Mutanten. Alternativ können neue Pflanzen mit veränderten Eigenschaften mit Hilfe gentechnischer Verfahren erzeugt werden (siehe z.B. EP 0221044, EP 0131624). Beschrieben wurden beispielsweise in mehreren Fällen

- gentechnische Veränderungen von Kulturpflanzen zwecks Modifikation der in den Pflanzen synthetisierten Stärke (z.B. WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A),
- transgene Kulturpflanzen, welche gegen bestimmte Herbizide vom Typ

- Glufosinate (vgl. z.B. EP 0 242 236 A, EP 0 242 246 A) oder Glyphosate (WO 92/000377 A) oder der Sulfonylharnstoffe (EP 0 257 993 A, US 5,013,659) oder gegen Kombinationen oder Mischungen dieser Herbizide durch „gene stacking“ resistent sind, wie transgenen Kulturpflanzen z. B. Mais oder Soja mit dem Handelsnamen oder der Bezeichnung Optimum™ GAT™ (Glyphosate ALS Tolerant).
- 5
- transgene Kulturpflanzen, beispielsweise Baumwolle, mit der Fähigkeit *Bacillus thuringiensis*-Toxine (Bt-Toxine) zu produzieren, welche die Pflanzen gegen bestimmte Schädlinge resistent machen (EP 0 142 924 A, EP 0 193 259 A).
- 10
- transgene Kulturpflanzen mit modifizierter Fettsäurezusammensetzung (WO 91/013972 A).
  - gentechnisch veränderte Kulturpflanzen mit neuen Inhalts- oder Sekundärstoffen z.B. neuen Phytoalexinen, die eine erhöhte Krankheitsresistenz verursachen (EP 0 309 862 A, EP 0 464 461 A)
- 15
- gentechnisch veränderte Pflanzen mit reduzierter Photorespiration, die höhere Erträge und höhere Stresstoleranz aufweisen (EP 0 305 398 A)
  - transgene Kulturpflanzen, die pharmazeutisch oder diagnostisch wichtige Proteine produzieren („molecular pharming“)
  - transgene Kulturpflanzen, die sich durch höhere Erträge oder bessere Qualität auszeichnen
- 20
- transgene Kulturpflanzen die sich durch Kombinationen z.B. der o. g. neuen Eigenschaften auszeichnen („gene stacking“)

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

25

Für derartige gentechnische Manipulationen können Nucleinsäuremoleküle in Plasmide eingebracht werden, die eine Mutagenese oder eine Sequenzveränderung durch Rekombination von DNA-Sequenzen erlauben. Mit Hilfe von

30

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

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA, einer sense-RNA zur Erzielung eines Cosuppressionseffektes oder die Expression mindestens eines entsprechend konstruierten Ribozyms, das spezifisch Transkripte des obengenannten Genprodukts spaltet.

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

Bei der Expression von Nucleinsäuremolekülen in Pflanzen kann das synthetisierte Protein in jedem beliebigen Kompartiment der pflanzlichen Zelle lokalisiert sein. Um aber die Lokalisation in einem bestimmten Kompartiment zu erreichen, kann z.B. die codierende Region mit DNA-Sequenzen verknüpft werden, die die Lokalisierung in einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige Sequenzen sind dem Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). Die Expression der Nucleinsäuremoleküle kann auch in den Organellen der Pflanzenzellen stattfinden.

Die transgenen Pflanzenzellen können nach bekannten Techniken zu ganzen

Pflanzen regeneriert werden. Bei den transgenen Pflanzen kann es sich prinzipiell um Pflanzen jeder beliebigen Pflanzenspezies handeln, d.h., sowohl monokotyle als auch dikotyle Pflanzen.

- 5 So sind transgene Pflanzen erhältlich, die veränderte Eigenschaften durch Überexpression, Suppression oder Inhibierung homologer (= natürlicher) Gene oder Gensequenzen oder Expression heterologer (= fremder) Gene oder Gensequenzen aufweisen.
- 10 Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen in transgenen Kulturen eingesetzt werden, welche gegen Wachstumsstoffe, wie z.B. 2,4 D, Dicamba oder gegen Herbizide, die essentielle Pflanzenenzyme, z.B. Acetolactatsynthasen (ALS), EPSP Synthasen, Glutaminsynthasen (GS) oder Hydroxyphenylpyruvat Dioxygenasen (HPPD) hemmen, respektive gegen Herbizide aus der Gruppe der
- 15 Sulfonharnstoffe, der Glyphosate, Glufosinate oder Benzoylisoxazole und analogen Wirkstoffe, oder gegen beliebige Kombinationen dieser Wirkstoffe, resistent sind.

- Besonders bevorzugt können die erfindungsgemäßen Verbindungen in transgenen Kulturpflanzen eingesetzt werden, die gegen eine Kombination von Glyphosaten und
- 20 Glufosinaten, Glyphosaten und Sulfonharnstoffen oder Imidazolinonen resistent sind. Ganz besonders bevorzugt können die erfindungsgemäßen Verbindungen in transgenen Kulturpflanzen wie z. B. Mais oder Soja mit dem Handelsnamen oder der Bezeichnung Optimum<sup>TM</sup> GAT<sup>TM</sup> (Glyphosate ALS Tolerant) eingesetzt werden.

- 25 Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen in transgenen Kulturen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schädlingen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes Unkrautspektrum, das bekämpft werden kann, veränderte
- 30 Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können, vorzugsweise gute Kombinierbarkeit mit den Herbiziden, gegenüber denen die transgene Kultur

resistent ist, sowie Beeinflussung von Wuchs und Ertrag der transgenen Kulturpflanzen.

5 Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen als Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in transgenen Kulturpflanzen.

10 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können z.B. in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, welche die erfindungsgemäßen Verbindungen enthalten.

15 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, 20 Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln und Wachse. 25 Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

30

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden

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

10

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

15

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z.B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine,

20

Fettalkoholpolyglykoethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutylnaphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoilmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden Wirkstoffe

25

beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

30

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren

können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-Dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykoether, Fettalkoholpolyglykoether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie  
5 z.B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

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

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

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

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebmitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem  
25 Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

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

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

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

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0.1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0.1 bis 95 Gew.-%, erfindungsgemäße Verbindungen.  
In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der  
15 Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0.05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-%  
20 Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

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

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

Wirkstoffe, wie Insektizide, Fungizide, Pflanzenwachstumsregulatoren oder Herbizide geeignet. Beispiele derartiger Herbizide sind solche, die auf einer Inhibition von beispielsweise Acetolactat-Synthase, Acetyl-CoA-Carboxylase, Cellulose-Synthase, Enolpyruvylshikimat-3-phosphat-Synthase, Glutamin-Synthetase, p-Hydroxyphenylpyruvat-Dioxygenase, Phytoendesaturase, Photosystem I, Photosystem II, Protoporphyrinogen-Oxidase beruhen, einsetzbar, wie sie z.B. aus Weed Research 26 (1986) 441 445 oder "The Pesticide Manual", 14th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als bekannte Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen oder mit der Codenummer bezeichnet) und umfassen stets sämtliche Anwendungsformen wie Säuren, Salze, Ester und Isomere wie Stereoisomere und optische Isomere. Dabei sind beispielhaft eine und zum Teil auch mehrere Anwendungsformen genannt:

Acetochlor, Acibenzolar, Acibenzolar-S-methyl, Acifluorfen, Acifluorfen-natrium, Aclonifen, Alachlor, Allidochlor, Alloxymid, Alloxymid-natrium, Ametryn, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Aminocyclopyrachlor, Aminopyralid, Amitrole, Ammoniumsulfamat, Ancymidol, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Aziprotryn, BAH-043, BAS-140H, BAS-693H, BAS-714H, BAS-762H, BAS-776H, Beflubutamid, Benazolin, Benazolin-ethyl, bencarbazone, Benfluralin, Benfuresate, Bensulide, Bensulfuron-methyl, Bentazone, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzofluor, Benzoylprop, Bifenox, Bilanafos, Bilanafos-natrium, Bispyribac, Bispyribac-natrium, Bromacil, Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Bromuron, Buminafos, Busoxinone, Butachlor, Butafenacil, Butamifos, Butenachlor, Butralin, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Carbetamide, Carfentrazone, Carfentrazone-ethyl, Chlormethoxyfen, Chloramben, Chlorazifop, Chlorazifop-butyl, Chlorbromuron, Chlorbufam, Chlorfenac, Chlorfenac-natrium, Chlorfenprop, Chlorflurenol, Chlorflurenol-methyl, Chloridazon, Chlorimuron,

Chlorimuron-ethyl, Chlormequat-chlorid, Chlornitrofen, Chlorophthalim, Chlorthal-  
 dimethyl, Chlorotoluron, Chlorsulfuron, Cinidon, Cinidon-ethyl, Cinmethylin,  
 Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop Clodinafop-propargyl, Clofencet, Clomazone,  
 Clomeprop, Cloprop, Ciopyraiid, Cioransulam, Cloransulam-methyl, Cumyluron,  
 5 Cyanamide, Cyanazine, Cyclanilide, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim,  
 Cycluron, Cyhalofop, Cyhalofop-butyl, Cyperquat, Cyprazine, Cyprazole, 2,4-D, 2,4-  
 DB, Daimuron/Dymron, Dalapon, Daminozide, Dazomet, n-Decanol, Desmedipham,  
 Desmetryn, Detosyl-Pyrazolate (DTP), Diallate, Dicamba, Dichlobenil, Dichlorprop,  
 Dichlorprop-P, Diclofop, Diclofop-methyl, Diclofop-P-methyl, Diclosulam, Diethatyl,  
 10 Diethatyl-ethyl, Difenoxuron, Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Diflufenzopyr-  
 natrium, Dimefuron, Dikegulac-natrium, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor,  
 Dimethametryn, Dimethenamid, Dimethenamid-P, Dimethipin, Dimetrasulfuron,  
 Dinitramine, Dinoseb, Dinoterb, Diphenamid, Dipropetryn, Diquat, Diquat-dibromide,  
 Dithiopyr, Diuron, DNOC, Eglinazine-ethyl, Endothal, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin,  
 15 Ethametsulfuron-methyl, Ethephon, Ethidimuron, Ethiozin, Ethofumesate, Ethoxyfen,  
 Ethoxyfen-ethyl, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, F-5331, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-  
 (3-fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid,  
 Fenoprop, Fenoxaprop, Fenoxaprop-P, Fenoxaprop-ethyl, Fenoxaprop-P-ethyl,  
 Fentrazamide, Fenuron, Flamprop, Flamprop-M-isopropyl, Flamprop-M-methyl,  
 20 Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop, Fluazifop-P, Fluazifop-butyl, Fluazifop-P-butyl,  
 Fluazolate, Flucarbazone, Flucarbazone-natrium, Flucetosulfuron, Fluchloralin,  
 Flufenacet (Thiafluamide), Flufenpyr, Flufenpyr-ethyl, Flumetralin, Flumetsulam,  
 Flumiclorac, Flumiclorac-pentyl, Flumioxazin, Flumipropyn, Fluometuron,  
 Fluorodifen, Fluoroglycofen, Fluoroglycofen-ethyl, Flupoxam, Flupropacil,  
 25 Flupropanate, Flupyr-sulfuron, Flupyr-sulfuron-methyl-natrium, Flurenol, Flurenol-  
 butyl, Fluridone, Flurochloridone, Fluroxypyr, Fluroxypyr-meptyl, Flurprimidol,  
 Flurtamone, Fluthiacet, Fluthiacet-methyl, Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron,  
 Forchlorfenuron, Fosamine, Furyloxyfen, Gibberellinsäure, Glufosinate, Glufosinate-  
 ammonium, Glufosinate-P, Glufosinate-P-ammonium, Glufosinate-P-natrium,  
 30 Glyphosate, Glyphosate-isopropylammonium, H-9201, Halosafen, Halosulfuron,  
 Halosulfuron-methyl, Haloxyfop, Haloxyfop-P, Haloxyfop-ethoxyethyl, Haloxyfop-P-  
 ethoxyethyl, Haloxyfop-methyl, Haloxyfop-P-methyl, Hexazinone, HNPC-9908, HW-

02, Imazamethabenz, Imazamethabenz-methyl, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Inabenfide, Indanofan, Indaziflam, Indolessigsäure (IAA), 4-Indol-3-ylbuttersäure (IBA), Iodosulfuron, Iodosulfuron-methyl-natrium, ioxynil, ipfencarbazone, Isocarbamid, Isopropalin, Isoproturon,

5 Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, KUH-043, KUH-071, Karbutilate, Ketospiradox, Lactofen, Lenacil, Linuron, Maleinsäurehydrazid, MCPA, MCPB, MCPB-methyl, -ethyl und -natrium, Mecoprop, Mecoprop-natrium, Mecoprop-butotyl, Mecoprop-P-butotyl, Mecoprop-P-dimethylammonium, Mecoprop-P-2-ethylhexyl, Mecoprop-P-kalium, Mefenacet, Mefluidide, Mepiquat-chlorid,

10 Mesosulfuron, Mesosulfuron-methyl, Mesotrione, Methabenzthiazuron, Metam, Metamifop, Metamitron, Metazachlor, Methazole, Methiozolin, Methoxyphenone, Methyldymron, 1-Methylcyclopropen, Methylisothiocyanat, Metobenzuron, Metobromuron, Metolachlor, S-Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron, Metsulfuron-methyl, Molinate, Monalide, Monocarbamide,

15 Monocarbamide-dihydrogensulfat, Monolinuron, Monosulfuron, Monuron, MT 128, MT-5950, d. h. N-[3-Chlor-4-(1-methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid, NGGC-011, Naproanilide, Napropamide, Naptalam, NC-310, d.h. 4-(2,4-dichlorobenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxy-pyrazole, NC-620, Neburon, Nicosulfuron, Nipyraclofen, Nitralin, Nitrofen, Nitrophenolat-natrium (Isomerengemisch), Nitrofluorfen, Nonansäure,

20 Norflurazon, Orbencarb, Orthosulfamuron, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paclobutrazol, Paraquat, Paraquat-dichlorid, Pelargonsäure (Nonansäure), Pendimethalin, Pendralin, Penoxsulam, Pentanochlor, Pentoxazone, Perfluidone, Pethoxamid, Phenisopham, Phenmedipham, Phenmedipham-ethyl, Picloram, Picolinafen, Pinoxaden,

25 Piperophos, Pirifenop, Pirifenop-butyl, Pretilachlor, Primisulfuron, Primisulfuron-methyl, Probenazole, Profluazol, Procyazine, Prodiamine, Prifluraline, Profoxydim, Prohexadione, Prohexadione-calcium, Prohydrojasmone, Prometon, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propazine, Propham, Propisochlor, Propoxycarbazone, Propoxycarbazone-natrium, Propyrisulfuron, Propyzamide,

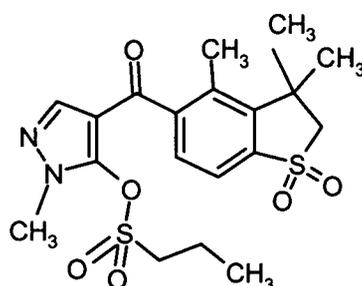
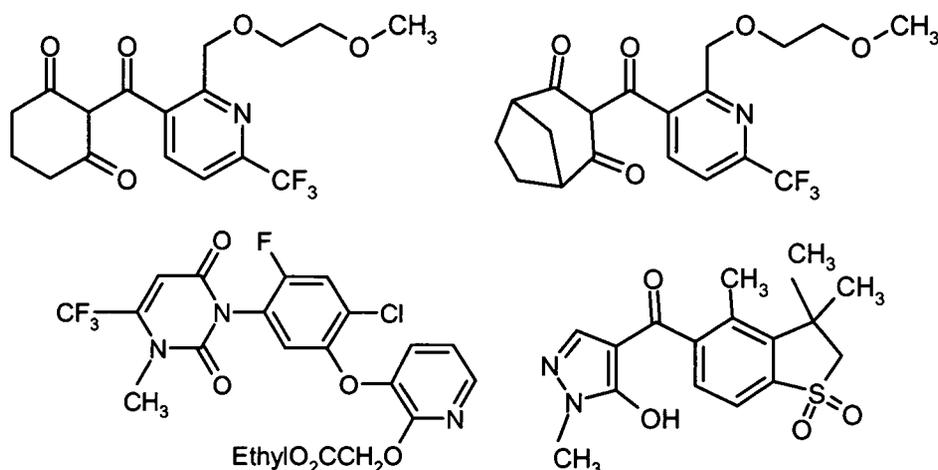
30 Prosulfalin, Prosulfocarb, Prosulfuron, Prynachlor, Pyraclonil, Pyraflufen, Pyraflufen-ethyl, Pyrasulfotole, Pyrazolynate (Pyrazolate), Pyrazosulfuron-ethyl, Pyrazoxyfen, Pyribambenz, Pyribambenz-isopropyl, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridafol,

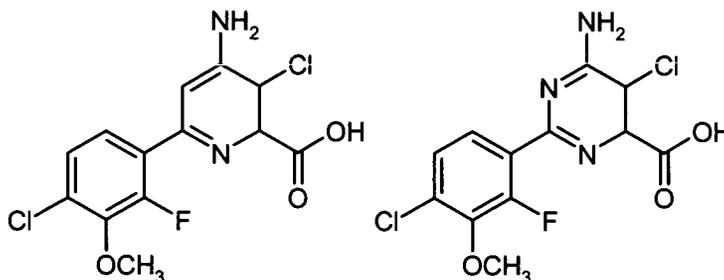
Pyridate, Pyrifthalid, Pyriminobac, Pyriminobac-methyl, Pyrimisulfan, Pyriithiobac, Pyriithiobac-natrium, Pyroxasulfone, Pyroxulam, Quinclorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop, Quizalofop-ethyl, Quizalofop-P, Quizalofop-P-ethyl, Quizalofop-P-tefuryl, Rimsulfuron, Saflufenacil, Secbumeton, Sethoxydim, Siduron,

5 Simazine, Simetryn, SN-106279, Sulcotrione, Sulfallate (CDEC), Sulfentrazone, Sulfometuron, Sulfometuron-methyl, Sulfosate (Glyphosate-trimesium), Sulfosulfuron, SYN-449, SYN-523, SYP-249, SYP-298, SYP-300, Tebutam, Tebuthiuron, Tecnazene, Tefuryltrione, Tembotrione, Tepraloxymid, Terbacil, Terbucarb, Terbuchlor, Terbumeton, Terbuthylazine, Terbutryn, Thenylchlor,

10 Thiafluamide, Thiazafluron, Thiazopyr, Thidiazimin, Thidiazuron, Thiencarbazone, Thiencarbazone-methyl, Thifensulfuron, Thifensulfuron-methyl, Thiobencarb, Tiocarbazil, Topramezone, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Triaziflam, Triazofenamid, Tribenuron, Tribenuron-methyl, Trichloressigsäure (TCA), Triclopyr, Tridiphane, Trietazine, Trifloxysulfuron, Trifloxysulfuron-natrium, Trifluralin,

15 Triflusulfuron, Triflusulfuron-methyl, Trimeturon, Trinexapac, Trinexapac-ethyl, Tritosulfuron, Tsitodef, Uniconazole, Uniconazole-P, Vernolate, ZJ-0166, ZJ-0270, ZJ-0543, ZJ-0862 sowie die folgenden Verbindungen





5

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

20

Folgende Gruppen von Verbindungen kommen beispielsweise als Safener in Frage:

S1) Verbindungen aus der Gruppe heterocyclischer Carbonsäurederivate:

S1<sup>a</sup>) Verbindungen vom Typ der Dichlorphenylpyrazolin-3-carbonsäure (S1<sup>a</sup>), vorzugsweise Verbindungen wie

25

1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäure,  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäure-

ethylester (S1-1) ("Mefenpyr-diethyl"), und verwandte Verbindungen, wie sie in der WO-A-91/07874 beschrieben sind;

- 5 S1<sup>b</sup>) Derivate der Dichlorphenylpyrazolcarbonsäure (S1<sup>b</sup>),  
vorzugsweise Verbindungen wie  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-methylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-2),  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-isopropylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-3),  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(1,1-dimethyl-ethyl)pyrazol-3-carbonsäureethylester  
10 (S1-4) und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-333 131 und  
EP-A-269 806 beschrieben sind;
- S1<sup>c</sup>) Derivate der 1,5-Diphenylpyrazol-3-carbonsäure (S1<sup>c</sup>),  
vorzugsweise Verbindungen wie  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-phenylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-5),  
15 1-(2-Chlorphenyl)-5-phenylpyrazol-3-carbonsäuremethylester (S1-6)  
und verwandte Verbindungen wie sie beispielsweise in der EP-A-268554  
beschrieben sind;
- 20 S1<sup>d</sup>) Verbindungen vom Typ der Triazolcarbonsäuren (S1<sup>d</sup>),  
vorzugsweise Verbindungen wie Fenchlorazol(-ethylester), d.h.  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-trichlormethyl-(1H)-1,2,4-triazol-3-carbonsäure-  
ethylester (S1-7), und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-174 562 und  
EP-A-346 620 beschrieben sind;
- 25 S1<sup>e</sup>) Verbindungen vom Typ der 5-Benzyl- oder 5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbon-  
säure, oder der 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure (S1<sup>e</sup>),  
vorzugsweise Verbindungen wie  
5-(2,4-Dichlorbenzyl)-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-8) oder  
5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-9) und verwandte  
30 Verbindungen, wie sie in WO-A-91/08202 beschrieben sind, bzw.  
5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-carbonsäure (S1-10) oder 5,5-Diphenyl-2-  
isoxazolin-carbonsäureethylester (S1-11) ("Isoxadifen-ethyl") oder

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

- 5 S2) Verbindungen aus der Gruppe der 8-Chinolinyloxyderivate (S2):  
S2<sup>a</sup>) Verbindungen vom Typ der 8-Chinolinoxinessigsäure (S2<sup>a</sup>), vorzugsweise  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-(1-methylhexyl)-ester ("Cloquintocet-  
mexyl") (S2-1), (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-(1,3-dimethyl-but-1-yl)-ester  
10 (S2-2), (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-4-allyl-oxy-butylester (S2-3),  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-1-allyloxy-prop-2-ylester (S2-4),  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäureethylester (S2-5),  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäuremethylester (S2-6),  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäureallylester (S2-7),  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-2-(2-propyliden-iminoxy)-1-ethylester  
15 (S2-8), (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-2-oxo-prop-1-ylester (S2-9) und  
verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-86 750, EP-A-94 349 und  
EP-A-191 736 oder EP-A-0 492 366 beschrieben sind, sowie (5-Chlor-8-  
chinolinoxinessigsäure (S2-10), deren Hydrate und Salze, beispielsweise  
deren Lithium-, Natrium-, Kalium-, Kalzium-, Magnesium-, Aluminium-, Eisen-,  
20 Ammonium-, quartäre Ammonium-, Sulfonium-, oder Phosphoniumsalze wie  
sie in der WO-A-2002/34048 beschrieben sind;
- S2<sup>b</sup>) Verbindungen vom Typ der (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure (S2<sup>b</sup>),  
vorzugsweise Verbindungen wie (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-  
25 diethylester, (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäurediallylester,  
(5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-methyl-ethylester und verwandte  
Verbindungen, wie sie in EP-A-0 582 198 beschrieben sind.
- S3) Wirkstoffe vom Typ der Dichloracetamide (S3), die häufig als Vorauf-  
30 laufsafener (bodenwirksame Safener) angewendet werden, wie z. B.  
"Dichlormid" (N,N-Diallyl-2,2-dichloracetamid) (S3-1),  
"R-29148" (3-Dichloracetyl-2,2,5-trimethyl-1,3-oxazolidin) der Firma Stauffer

(S3-2),

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

(S3-3),

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

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

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

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

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

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

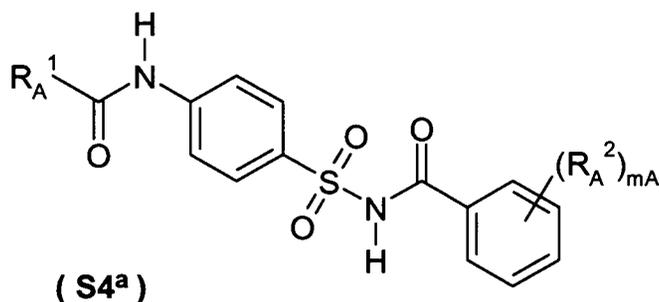
(3-Dichloracetyl-2,5,5-trimethyl-1,3-diazabicyclo[4.3.0]nonan) der Firma BASF,

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

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

S4<sup>a</sup>) N-Acylsulfonamide der Formel (S4<sup>a</sup>) und deren Salze wie sie in der

20 WO-A-97/45016 beschrieben sind,



worin

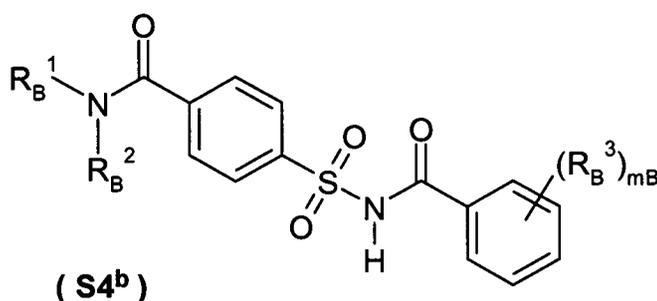
25 R<sub>A</sub><sup>1</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, welches durch v<sub>A</sub> Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch durch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl substituiert ist;

$R_A^2$  Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, CF<sub>3</sub>;

$m_A$  1 oder 2;

$v_A$  ist 0, 1, 2 oder 3 bedeuten;

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



10 worin

$R_B^1, R_B^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl,  
(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Alkynyl,

$R_B^3$  Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy und

$m_B$  1 oder 2 bedeuten,

15

z.B. solche worin

$R_B^1 =$  Cyclopropyl,  $R_B^2 =$  Wasserstoff und  $(R_B^3) = 2\text{-OMe}$  ist  
(S4-1, "Cyprosulfamide"),

$R_B^1 =$  Cyclopropyl,  $R_B^2 =$  Wasserstoff und  $(R_B^3) = 5\text{-Cl-2-OMe}$  ist (S4-2),

20  $R_B^1 =$  Ethyl,  $R_B^2 =$  Wasserstoff und  $(R_B^3) = 2\text{-OMe}$  ist (S4-3),

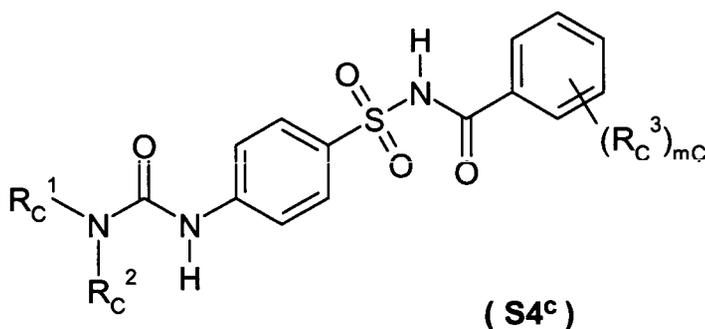
$R_B^1 =$  Isopropyl,  $R_B^2 =$  Wasserstoff und  $(R_B^3) = 5\text{-Cl-2-OMe}$  ist (S4-4) und

$R_B^1 =$  Isopropyl,  $R_B^2 =$  Wasserstoff und  $(R_B^3) = 2\text{-OMe}$  ist (S4-5).

25

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

43



worin

$R_C^1$ ,  $R_C^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl,  
 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Alkinyl,

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

$m_C$  1 oder 2 bedeuten;

beispielsweise

- 10 1-[4-(N-2-Methoxybenzoylsulfamoyl)phenyl]-3-methylharnstoff,  
 1-[4-(N-2-Methoxybenzoylsulfamoyl)phenyl]-3,3-dimethylharnstoff,  
 1-[4-(N-4,5-Dimethylbenzoylsulfamoyl)phenyl]-3-methylharnstoff.

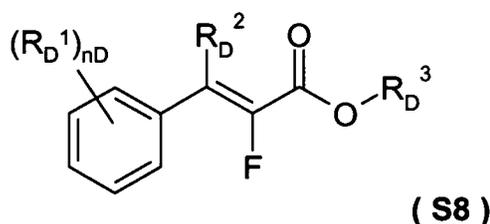
- 15 S5) Wirkstoffe aus der Klasse der Hydroxyaromaten und der aromatisch-  
 aliphatischen Carbonsäurederivate (S5), z.B.  
 3,4,5-Triacetoxybenzoesäureethylester, 3,5-Dimethoxy-4-hydroxybenzoe-  
 säure, 3,5-Dihydroxybenzoesäure, 4-Hydroxysalicylsäure, 4-Fluorsalicyl-  
 säure, 2-Hydroxymethylsäure,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

- S6) Wirkstoffe aus der Klasse der 1,2-Dihydrochinoxalin-2-one (S6), z.B.  
 1-Methyl-3-(2-thienyl)-1,2-dihydrochinoxalin-2-on, 1-Methyl-3-(2-thienyl)-1,2-  
 dihydrochinoxalin-2-thion, 1-(2-Aminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-  
 25 chinoxalin-2-on-hydrochlorid, 1-(2-Methylsulfonylaminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-  
 dihydro-chinoxalin-2-on, wie sie in der WO-A-2005/112630 beschrieben sind.

S7) Verbindungen aus der Klasse der Diphenylmethoxyessigsäurederivate (S7), z.B. Diphenylmethoxyessigsäuremethylester (CAS-Reg.Nr. 41858-19-9) (S7-1), Diphenylmethoxyessigsäureethylester oder Diphenylmethoxyessigsäure wie sie in der WO-A-98/38856 beschrieben sind.

5

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



10 worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

$R_D^1$  ist Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy,

$R_D^2$  ist Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl

$R_{D3}$  ist Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, oder Aryl,

15 wobei jeder der vorgenannten C-haltigen Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe, bestehend aus Halogen und Alkoxy substituiert ist; oder deren Salze

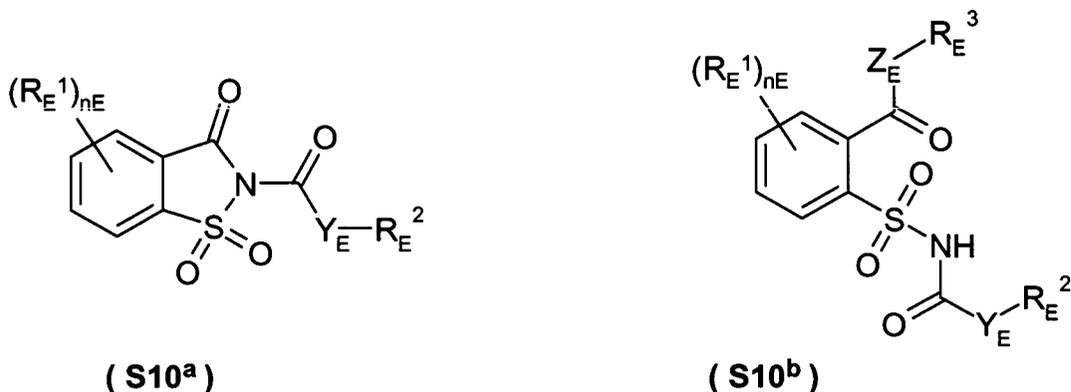
$n_D$  ist eine ganze Zahl von 0 bis 2.

20

S9) Wirkstoffe aus der Klasse der 3-(5-Tetrazolylcarbonyl)-2-chinolone (S9), z.B. 1,2-Dihydro-4-hydroxy-1-ethyl-3-(5-tetrazolylcarbonyl)-2-chinolon (CAS-Reg. Nr. 219479-18-2), 1,2-Dihydro-4-hydroxy-1-methyl-3-(5-tetrazolylcarbonyl)-2-chinolon (CAS-Reg. Nr. 95855-00-8), wie sie in der

25 WO-A-1999/000020 beschrieben sind.

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



worin

- 5      $R_E^1$      Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, Methoxy, Nitro, Cyano, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>  
 $Y_E, Z_E$      unabhängig voneinander O oder S,  
 $n_E$      eine ganze Zahl von 0 bis 4,  
 $R_E^2$      (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, Aryl, Benzyl, Halogenbenzyl,  
 $R_E^3$      Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl bedeuten.

10

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

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

15

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

20

"Cyometrinil" oder "CGA-43089" ((Z)-Cyanomethoxyimino(phenyl)acetonitril) (S11-3), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist.

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

25

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

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

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

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

10 "CL 304415" (CAS-Reg. Nr. 31541-57-8)  
(4-Carboxy-3,4-dihydro-2H-1-benzopyran-4-essigsäure) (S13-4) der Firma American Cyanamid, das als Safener für Mais gegen Schäden von Imidazolinonen bekannt ist,

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

"MG-838" (CAS-Reg. Nr. 133993-74-5)  
(2-propenyl 1-oxa-4-azaspiro[4.5]decane-4-carbodithioate) (S13-6) der Firma Nitrokemia

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

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

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

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

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

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

30 "Cumyluron" = "JC-940" (3-(2-Chlorphenylmethyl)-1-(1-methyl-1-phenylethyl)harnstoff, siehe JP-A-60087254), das als Safener für Reis gegen Schäden einiger Herbizide bekannt ist,

"Methoxyphenon" oder "NK 049" (3,3'-Dimethyl-4-methoxy-benzophenon), das als Safener für Reis gegen Schäden einiger Herbizide bekannt ist, "CSB" (1-Brom-4-(chlormethylsulfonyl)benzol) von Kumiai, (CAS-Reg. Nr. 54091-06-4), das als Safener gegen Schäden einiger Herbizide in Reis  
5 bekannt ist.

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

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

10 (4-Chlorphenoxy)essigsäure,

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

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

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

4-(4-Chlor-o-tolyloxy)buttersäure,

15 4-(4-Chlorphenoxy)buttersäure,

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

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

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

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

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen

gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten

5 Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der erfindungsgemäßen Verbindungen. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken,

10 z. B. zwischen 0,001 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

#### Beispiele

#### 15 A. Synthesebeispiele

Nachfolgend sind Synthesen erfindungsgemäßer Verbindungen beispielhaft beschrieben, ohne dass diese Beispiele limitierenden Charakter haben.

- 20 1. (6-Amino-5-chlor-2-(2,6-dichlorphenyl)pyrimidin-4-yl)propandinitril (Bsp. Nr. 174)
- Stufe A:
- Zu einer Lösung von 72 mg Malondinitril in 10 ml THF wird bei 0°C Natriumhydrid (45 mg als 60%ige Suspension in Mineralöl) zugegeben und die Mischung anschließend für 30 Minuten bei Raumtemperatur gerührt.
- 25 4,5,6-Trichlor-2-(2,6-dichlorphenyl)pyrimidin (0,30 g; analog folgender Vorschrift hergestellt: K. Findeisen, K. Wagner, Synthesis 1978, 40-42) wird zugegeben und die Reaktionsmischung bei Raumtemperatur über Nacht gerührt. Der Ansatz wird auf 10 ml gesättigte Ammoniumchlorid-Lösung gegeben, mehrmals mit Ethylacetat extrahiert und die vereinigten organischen Phasen mit gesättigter
- 30 Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach dem Trocknen über Magnesiumsulfat wird das Lösungsmittel im Vakuum eingeengt, wodurch Verbindung Nr. 534 erhalten wird.

## Stufe B:

Das erhaltene Produkt wird in 5 ml konzentrierter Ammoniaklösung suspendiert und 8 Stunden lang bei 150°C im geschlossenen Gefäß in einem

- 5 Mikrowellengerät zur Reaktion gebracht. Die Lösung wird anschließend im Vakuum auf das halbe Volumen eingengt und mit 2N Salzsäure angesäuert. Der ausgefallene Feststoff wird mit Wasser und Ethylacetat gewaschen und anschließend getrocknet. Es werden 0,19 g (61% der Theorie) des gewünschten Produkts erhalten.

10

2. [6-Amino-5-chlor-2-phenylpyrimidin-4-yl]propandinitril (Bsp. Nr. 1)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 174 dargestellt. Die Ausgangssubstanz, 4,5,6-Trichlor-2-phenylpyrimidin erhält man nach literaturbekannter Methode: K. Findeisen, K. Wagner, Synthesis 1978, 40-42.

15

3. [6-Amino-5-chlor-2-(4-chlorphenyl)pyrimidin-4-yl]propandinitril (Bsp. Nr. 29)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 174 dargestellt. Die Ausgangssubstanz, 4,5,6-Trichlor-2-(4-chlorphenyl)pyrimidin erhält man nach literaturbekannter Methode: K. Findeisen, K. Wagner, Synthesis 1978, 40-42.

20

4. [5-Chlor-2-(4-chlorphenyl)-6-(methylamino)pyrimidin-4-yl]propandinitril (Bsp. Nr. 41)

Die Substanz erhält man analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 174. In der Stufe B wird jedoch Methylamin (40% Lösung in MeOH) eingesetzt und die Reaktion bei 25 120°C für eine Stunde im Mikrowellengerät durchgeführt.

25

5. [6-Amino-5-chlor-2-(3-fluorphenyl)pyrimidin-4-yl]propandinitril (Bsp. Nr. 80)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 174 dargestellt. Die Ausgangssubstanz, 4,5,6-Trichlor-2-(3-fluorphenyl)pyrimidin erhält man analog 30 der literaturbekannten Methode: K. Findeisen, K. Wagner, Synthesis 1978, 40-42.

30

## 6. (6-Amino-5-chlor-2-methylpyrimidin-4-yl)propandinitril (Bsp. Nr. 272)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 174 dargestellt. Die Ausgangssubstanz, 4,5,6-Trichlor-2-methylpyrimidin erhält man nach literaturbekannter Methode: H. Gershon, K. Dittmer, R. Braun, J. Org. Chem. 1961, 26, 1874-1877.

## 7. (6-Amino-5-chlor-2-tert-butylpyrimidin-4-yl)propandinitril (Bsp. Nr. 277)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 174 dargestellt. Die Ausgangssubstanz, 4,5,6-Trichlor-2-tert-butylpyrimidin erhält man in Analogie zur literaturbekannten Methode: H. Gershon, K. Dittmer, R. Braun, J. Org. Chem. 1961, 26, 1874-1877.

## 8. Ammonium-[6-amino-5-chlor-2-(2,6-dichlorphenyl)pyrimidin-4-yl](dicyan)methanid (Bsp. Nr. 371)

Es werden 100 mg der Verbindung Bsp. Nr. 174 in Ammoniaklösung (2M in EtOH, 2ml) vollständig gelöst, im Vakuum bei 40°C eingeengt und der erhaltene Feststoff getrocknet. Es werden 104 mg des gewünschten Produkts erhalten.

## 9. Ammonium-[6-amino-5-chlor-2-phenylpyrimidin-4-yl](dicyan)methanid (Bsp. Nr. 288)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 371 dargestellt.

## 10. Natrium-[6-amino-5-chlor-2-(4-chlorphenyl)-pyrimidin-4-yl](dicyan)methanid (Bsp. Nr. 304)

Durch Zugabe einer stöchiometrischen Menge von Natriummethylat zur in Ethanol gelösten Verbindung Bsp. Nr. 29 kann das entsprechende Natriumsalz nach dem Einengen im Vakuum und anschließendem Trocknen erhalten werden.

## 11. Ammonium-[6-amino-5-chlor-2-(4-chlorphenyl)-pyrimidin-4-yl](dicyan)methanid (Bsp. Nr. 308)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 371 dargestellt.

12. Ammonium-[6-amino-5-chlor-2-(3-fluorphenyl)-pyrimidin-4-yl](dicyan)methanid  
(Bsp. Nr. 332)

Die Substanz wird analog der Vorschrift zu Bsp. Nr. 371 dargestellt.

- 5 Die in den nachfolgenden Tabellen 1 - 4 beschriebenen Verbindungen (Nr. 1 - 463) erhält man analog zu den oben beschriebenen Synthesebeispielen. Die in Tabelle 5 beschriebenen Verbindungen (Nr. 464 - 585) erhält man analog zu Synthesebeispiel A1, Stufe A.

10

In den Tabellen 1-5 bedeuten:

Me = Methyl

Et = Ethyl

cBu = Cyclobutyl

15 cPr = Cyclopropyl

iPr = Isopropyl

cHex = Cyclohexyl

tBu = tert-Butyl

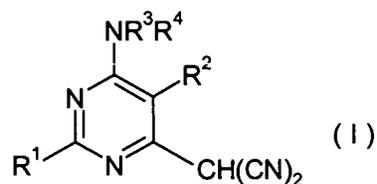
Ph = Phenyl

20 Vin = Vinyl

Ac = Acetyl

Hal = Halogen

Tabelle 1: Verbindungen der Formel (I)



Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
1.	Ph	Cl	H	H
2.	Ph	Br	H	H
3.	Ph	Cl	H	Ac
4.	Ph	Br	H	Ac
5.	Ph	Cl	H	Me
6.	Ph	Br	H	Me
7.	4-OMe-Ph	Cl	H	H
8.	4-OMe-Ph	Br	H	H
9.	4-NO <sub>2</sub> -Ph	Cl	H	H
10.	4-NO <sub>2</sub> -Ph	Br	H	H
11.	4-Me-Ph	F	H	H
12.	4-Me-Ph	Cl	H	H
13.	4-Me-Ph	Br	H	H
14.	4-I-Ph	Cl	H	H
15.	4-I-Ph	Br	H	H
16.	4-I-Ph	Cl	H	Ac
17.	4-I-Ph	Br	H	Ac
18.	4-I-Ph	Cl	H	Me
19.	4-I-Ph	Br	H	Me
20.	4-F-Ph	Cl	H	H
21.	4-F-Ph	Br	H	H
22.	4-F-Ph	Cl	H	Ac
23.	4-F-Ph	Br	H	Ac
24.	4-F-Ph	Cl	H	Me

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
25.	4-F-Ph	Br	H	Me
26.	4-COOMe-Ph	Cl	H	H
27.	4-COOMe-Ph	Br	H	H
28.	4-Cl-Ph	F	H	H
29.	4-Cl-Ph	Cl	H	H
30.	4-Cl-Ph	Br	H	H
31.	4-Cl-Ph	I	H	H
32.	4-Cl-Ph	CN	H	H
33.	4-Cl-Ph	NO <sub>2</sub>	H	H
34.	4-Cl-Ph	NO <sub>2</sub>	H	Me
35.	4-Cl-Ph	Cl	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
36.	4-Cl-Ph	Br	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
37.	4-Cl-Ph	Cl	H	Ac
38.	4-Cl-Ph	Br	H	Ac
39.	4-Cl-Ph	Cl	H	Et
40.	4-Cl-Ph	Br	H	Et
41.	4-Cl-Ph	Cl	H	Me
42.	4-Cl-Ph	Br	H	Me
43.	4-Cl-Ph	Cl	Me	Me
44.	4-Cl-Ph	Br	Me	Me
45.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	H
46.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	H	H
47.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	Ac
48.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	H	Ac
49.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	Me
50.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	H	Me
51.	4-Br-Ph	F	H	H
52.	4-Br-Ph	Cl	H	H
53.	4-Br-Ph	Br	H	H
54.	4-Br-Ph	I	H	H

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
55.	4-Br-Ph	CN	H	H
56.	4-Br-Ph	NO <sub>2</sub>	H	H
57.	4-Br-Ph	Cl	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
58.	4-Br-Ph	Br	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
59.	4-Br-Ph	Cl	H	Ac
60.	4-Br-Ph	Br	H	Ac
61.	4-Br-Ph	Cl	H	Et
62.	4-Br-Ph	Br	H	Et
63.	4-Br-Ph	Cl	H	Me
64.	4-Br-Ph	Br	H	Me
65.	4-Br-Ph	Cl	Me	Me
66.	4-Br-Ph	Br	Me	Me
67.	3-OMe-4-F-Ph	F	H	H
68.	3-OMe-4-F-Ph	Cl	H	H
69.	3-OMe-4-F-Ph	Br	H	H
70.	3-OMe-4-Cl-Ph	F	H	H
71.	3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H
72.	3-OMe-4-Cl-Ph	Br	H	H
73.	3-Me-Ph	Cl	H	H
74.	3-Me-Ph	Br	H	H
75.	3-Me-Ph	F	H	H
76.	3-Me-4-Cl-Ph	F	H	H
77.	3-Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H
78.	3-Me-4-Cl-Ph	Br	H	H
79.	3-F-Ph	F	H	H
80.	3-F-Ph	Cl	H	H
81.	3-F-Ph	Br	H	H
82.	3-Cl-Ph	Cl	H	H
83.	3-Cl-Ph	Br	H	H
84.	3-CF <sub>3</sub> -Ph	F	H	H

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
85.	3-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	H
86.	3-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	H	H
87.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H
88.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Br	H	H
89.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	F	H	H
90.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	I	H	H
91.	3,6-di-Cl-Ph	F	H	H
92.	3,6-di-Cl-Ph	Cl	H	H
93.	3,6-di-Cl-Ph	Br	H	H
94.	3,5-di-Cl-Ph	F	H	H
95.	3,5-di-Cl-Ph	Cl	H	H
96.	3,5-di-Cl-Ph	Br	H	H
97.	3,5-di-CF <sub>3</sub> -Ph	F	H	H
98.	3,5-di-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	H
99.	3,5-di-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	H	H
100.	3,4-di-OMe-Ph	F	H	H
101.	3,4-di-OMe-Ph	Cl	H	H
102.	3,4-di-OMe-Ph	Br	H	H
103.	3,4-di-Cl-Ph	F	H	H
104.	3,4-di-Cl-Ph	Cl	H	H
105.	3,4-di-Cl-Ph	Br	H	H
106.	2-F-6-Cl-Ph	F	H	H
107.	2-F-6-Cl-Ph	Cl	H	H
108.	2-F-6-Cl-Ph	Br	H	H
109.	2-F-4-Cl-Ph	F	H	H
110.	2-F-4-Cl-Ph	Cl	H	H
111.	2-F-4-Cl-Ph	Br	H	H
112.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	H	H
113.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Br	H	H
114.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	H	Ac

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
115.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Br	H	Ac
116.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	H	Me
117.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Br	H	Me
118.	2-F-4,5-di-Cl-Ph	F	H	H
119.	2-F-4,5-di-Cl-Ph	Cl	H	H
120.	2-F-4,5-di-Cl-Ph	Br	H	H
121.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H
122.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Br	H	H
123.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Ac
124.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Br	H	Ac
125.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Me
126.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Br	H	Me
127.	2-F-3-SCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	F	H	H
128.	2-F-3-SCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H
129.	2-F-3-SCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Br	H	H
130.	2-F-3-S(O <sub>2</sub> )Me-4-Cl-Ph	F	H	H
131.	2-F-3-S(O <sub>2</sub> )Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H
132.	2-F-3-S(O <sub>2</sub> )Me-4-Cl-Ph	Br	H	H
133.	2-F-3-S(O)Me-4-Cl-Ph	F	H	H
134.	2-F-3-S(O)Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H
135.	2-F-3-S(O)Me-4-Cl-Ph	Br	H	H
136.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	F	H	H
137.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H
138.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	H	H
139.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	I	H	H
140.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	CN	H	H
141.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	NO <sub>2</sub>	H	H
142.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
143.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
144.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Ac

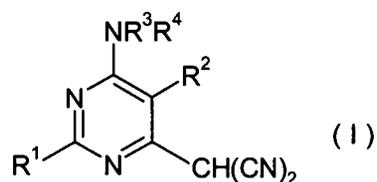
Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
145.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	H	Ac
146.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Et
147.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	H	Et
148.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Me
149.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	H	Me
150.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	Me	Me
151.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	Me	Me
152.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Cl	H	H
153.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Br	H	H
154.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Cl	H	Ac
155.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Br	H	Ac
156.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Cl	H	Me
157.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Br	H	Me
158.	2-F-3-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	F	H	H
159.	2-F-3-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H
160.	2-F-3-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Br	H	H
161.	2-F-3-NMe <sub>2</sub> -4-Cl-Ph	F	H	H
162.	2-F-3-NMe <sub>2</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H
163.	2-F-3-NMe <sub>2</sub> -4-Cl-Ph	Br	H	H
164.	2-F-3-Me-4-Cl-Ph	F	H	H
165.	2-F-3-Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H
166.	2-F-3-Me-4-Cl-Ph	Br	H	H
167.	2-Cl-Ph	F	H	H
168.	2-Cl-Ph	Cl	H	H
169.	2-Cl-Ph	Br	H	H
170.	2,6-di-F-3-OMe-4-Cl-Ph	F	H	H
171.	2,6-di-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H
172.	2,6-di-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	H	H
173.	2,6-di-Cl-Ph	F	H	H
174.	2,6-di-Cl-Ph	Cl	H	H

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
175.	2,6-di-Cl-Ph	Br	H	H
176.	2,5-di-Cl-Ph	F	H	H
177.	2,5-di-Cl-Ph	Cl	H	H
178.	2,5-di-Cl-Ph	Br	H	H
179.	2,4-di-F-5-OMe-Ph	F	H	H
180.	2,4-di-F-5-OMe-Ph	Cl	H	H
181.	2,4-di-F-5-OMe-Ph	Br	H	H
182.	2,4-di-F-3-OMe-Ph	F	H	H
183.	2,4-di-F-3-OMe-Ph	Cl	H	H
184.	2,4-di-F-3-OMe-Ph	Br	H	H
185.	2,4-di-Cl-Ph	F	H	H
186.	2,4-di-Cl-Ph	Cl	H	H
187.	2,4-di-Cl-Ph	Br	H	H
188.	2,4-di-Cl-Ph	F	H	Ac
189.	2,4-di-Cl-Ph	Cl	H	Ac
190.	2,4-di-Cl-Ph	Br	H	Ac
191.	2,4-di-Cl-5-F-Ph	F	H	H
192.	2,4-di-Cl-5-F-Ph	Cl	H	H
193.	2,4-di-Cl-5-F-Ph	Br	H	H
194.	2,4-di-Cl-3-OMe-Ph	F	H	H
195.	2,4-di-Cl-3-OMe-Ph	Cl	H	H
196.	2,4-di-Cl-3-OMe-Ph	Br	H	H
197.	2,4,6-tri-Cl-Ph	F	H	H
198.	2,4,6-tri-Cl-Ph	Cl	H	H
199.	2,4,6-tri-Cl-Ph	Br	H	H
200.	2,4-di-Me-Ph	Cl	H	H
201.	2,4-di-F-Ph	Cl	H	H
202.	2,3-di-F-4-Me-Ph	Cl	H	H
203.	2-NH <sub>2</sub> -5-F-Ph	Cl	H	H
204.	3-F-4-Me-Ph	Cl	H	H

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
205.	3-Me-4-F-Ph	Cl	H	H
206.	3-NO <sub>2</sub> -Ph	Cl	H	H
207.	2,3-di-Cl-Ph	Cl	H	H
208.	2-F-4-Br-Ph	Cl	H	H
209.	2-F-4-Me-Ph	Cl	H	H
210.	3,5-di-F-4-Cl-Ph	Cl	H	H

Tabelle 2: Verbindungen der Formel (I)

5

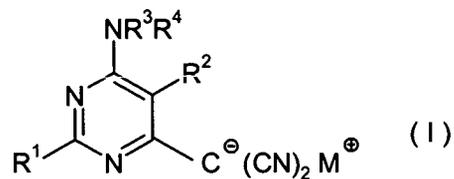


Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
211.	1-Cl-cPr	F	H	H
212.	1-Cl-cPr	Cl	H	H
213.	1-Cl-cPr	Br	H	H
214.	1-Cl-cPr	Cl	H	Ac
215.	1-Cl-cPr	Br	H	Ac
216.	1-Cl-cPr	Cl	H	Me
217.	1-Cl-cPr	Br	H	Me
218.	2-cPr-Vin	Cl	H	H
219.	2-cPr-Vin	Br	H	H
220.	2-di-Me-cPr	F	H	H
221.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H
222.	2-di-Me-cPr	Br	H	H
223.	2-di-Me-cPr	Cl	H	Ac
224.	2-di-Me-cPr	Br	H	Ac

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
225.	2-di-Me-cPr	Cl	H	Me
226.	2-di-Me-cPr	Br	H	Me
227.	2-Me-Vin	Cl	H	H
228.	2-Me-Vin	Br	H	H
229.	2-Ph-Vin	Cl	H	H
230.	2-Ph-Vin	Br	H	H
231.	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Cl	H	H
232.	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Br	H	H
233.	cBu	F	H	H
234.	cBu	Cl	H	H
235.	cBu	Br	H	H
236.	CF <sub>3</sub>	F	H	H
237.	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H
238.	CF <sub>3</sub>	Br	H	H
239.	cHex	F	H	H
240.	cHex	Cl	H	H
241.	cHex	Br	H	H
242.	cHex	Cl	H	Ac
243.	cHex	Br	H	Ac
244.	cHex	Cl	H	Me
245.	cHex	Br	H	Me
246.	cPr	Cl	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
247.	cPr	Br	=CHN(Me) <sub>2</sub>	
248.	cPr	F	H	H
249.	cPr	Cl	H	H
250.	cPr	Br	H	H
251.	cPr	I	H	H
252.	cPr	CN	H	H
253.	cPr	NO <sub>2</sub>	H	H
254.	cPr	Cl	H	Ac

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
255.	cPr	Br	H	Ac
256.	cPr	Cl	H	Et
257.	cPr	Br	H	Et
258.	cPr	Cl	H	Me
259.	cPr	Br	H	Me
260.	cPr	Cl	Me	Me
261.	cPr	Br	Me	Me
262.	Hex	Cl	H	H
263.	Hex	Br	H	H
264.	iPr	F	H	H
265.	iPr	Cl	H	H
266.	iPr	Br	H	H
267.	iPr	I	H	H
268.	iPr	Cl	H	Ac
269.	iPr	Br	H	Ac
270.	iPr	Cl	H	Me
271.	iPr	Br	H	Me
272.	Me	Cl	H	H
273.	Me	Br	H	H
274.	PhCH <sub>2</sub>	Cl	H	H
275.	PhCH <sub>2</sub>	Br	H	H
276.	tBu	F	H	H
277.	tBu	Cl	H	H
278.	tBu	Br	H	H
279.	tBu	I	H	H
280.	Vin	F	H	H
281.	Vin	Cl	H	H
282.	Vin	Br	H	H

Tabelle 3: Salze der Verbindungen der Formel (I)



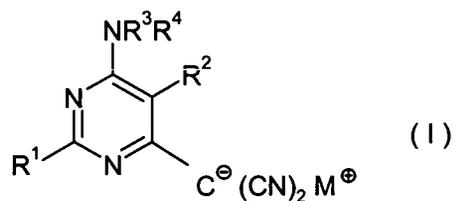
Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>⊕</sup>
283.	Ph	Cl	H	H	Li <sup>+</sup>
284.	Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
285.	Ph	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
286.	Ph	Cl	H	H	Ca <sup>2+</sup>
287.	Ph	Cl	H	H	Mg <sup>2+</sup>
288.	Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
289.	Ph	Cl	H	H	NH <sub>3</sub> Me <sup>+</sup>
290.	Ph	Cl	H	H	NH <sub>2</sub> Me <sub>2</sub> <sup>+</sup>
291.	Ph	Cl	H	H	NHMe <sub>3</sub> <sup>+</sup>
292.	Ph	Cl	H	H	NMe <sub>4</sub> <sup>+</sup>
293.	Ph	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
294.	4-OMe-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
295.	4-NO <sub>2</sub> -Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
296.	4-Me-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
297.	4-I-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
298.	4-F-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
299.	4-F-Ph	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
300.	4-F-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
301.	4-F-Ph	Cl	H	Ac	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
302.	4-F-Ph	Cl	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
303.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	Li <sup>+</sup>
304.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
305.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
306.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	Ca <sup>2+</sup>

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>®</sup>
307.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	Mg <sup>2+</sup>
308.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
309.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>3</sub> Me <sup>+</sup>
310.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>2</sub> Me <sub>2</sub> <sup>+</sup>
311.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	NHMe <sub>3</sub> <sup>+</sup>
312.	4-Cl-Ph	Cl	H	H	NMe <sub>4</sub> <sup>+</sup>
313.	4-Cl-Ph	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
314.	4-Cl-Ph	Cl	H	Ac	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
315.	4-Cl-Ph	Cl	H	Et	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
316.	4-Cl-Ph	Cl	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
317.	4-Cl-Ph	Cl	Me	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
318.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
319.	4-Br-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
320.	4-Br-Ph	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
321.	4-Br-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
322.	4-Br-Ph	Br	H	H	Na <sup>+</sup>
323.	4-Br-Ph	Br	H	H	K <sup>+</sup>
324.	4-Br-Ph	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
325.	4-Br-Ph	Cl	H	Ac	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
326.	4-Br-Ph	Cl	H	Et	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
327.	4-Br-Ph	Cl	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
328.	3-OMe-4-F-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
329.	3-OMe-4-F-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
330.	3-Me-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
331.	3-Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
332.	3-F-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
333.	3-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
334.	3-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
335.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
336.	3,6-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>⊕</sup>
337.	3,5-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
338.	3,5-di-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
339.	3,4-di-OMe-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
340.	3,4-di-Cl-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
341.	3,4-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
342.	2-F-6-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
343.	2-F-4-Cl-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
344.	2-F-4-Cl-Ph	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
345.	2-F-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
346.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
347.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
348.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	H	Ac	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
349.	2-F-4,5-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
350.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
351.	2-F-3-SCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
352.	2-F-3-S(O <sub>2</sub> )Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
353.	2-F-3-S(O)Me-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
354.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	Li <sup>+</sup>
355.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
356.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
357.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	Ca <sup>2+</sup>
358.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	Mg <sup>2+</sup>
359.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
360.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>3</sub> Me <sup>+</sup>
361.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>2</sub> Me <sub>2</sub> <sup>+</sup>
362.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NHMe <sub>3</sub> <sup>+</sup>
363.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NMe <sub>4</sub> <sup>+</sup>
364.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Ac	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
365.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
366.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>®</sup>
367.	2-F-3-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
368.	2-F-3-NMe <sub>2</sub> -4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
369.	2-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
370.	2,6-di-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
371.	2,6-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
372.	2,5-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
373.	2,4-di-F-5-OMe-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
374.	2,4-di-F-3-OMe-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
375.	2,4-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
376.	2,4-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
377.	2,4-di-Cl-5-F-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
378.	2,4-di-Cl-3-OMe-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
379.	2,4,6-tri-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
380.	2,3-di-Cl-Ph	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
381.	4-COOH-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
382.	2-F-4-Br-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
383.	2,4-di-F-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
384.	4-Cl-Ph	NO <sub>2</sub>	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
385.	3-F-4-Me-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
386.	3,5-di-F-4-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
387.	2,3-di-F-4-Me-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
388.	2,4-di-Me-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
389.	3-Me-4-F-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
390.	2,3-di-Cl-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
391.	2-F-4-Me-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
392.	2-F-4-Br-Ph	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
393.	4-Cl-Ph	Cl	Me	Me	Na <sup>+</sup>

Tabelle 4: Salze der Verbindungen der Formel (I)



Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>⊕</sup>
394.	1-Cl-cPr	F	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
395.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	Li <sup>+</sup>
396.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
397.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
398.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	Ca <sup>2+</sup>
399.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	Mg <sup>2+</sup>
400.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
401.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	NH <sub>3</sub> Me <sup>+</sup>
402.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	NH <sub>2</sub> Me <sub>2</sub> <sup>+</sup>
403.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	NHMe <sub>3</sub> <sup>+</sup>
404.	1-Cl-cPr	Cl	H	H	NMe <sub>4</sub> <sup>+</sup>
405.	1-Cl-cPr	Br	H	H	Na <sup>+</sup>
406.	1-Cl-cPr	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
407.	1-Cl-cPr	Cl	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
408.	1-Cl-cPr	Br	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
409.	2-cPr-Vin	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
410.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	Li <sup>+</sup>
411.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
412.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
413.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	Ca <sup>2+</sup>
414.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	Mg <sup>2+</sup>
415.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
416.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	NH <sub>3</sub> Me <sup>+</sup>

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>®</sup>
417.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	NH <sub>2</sub> Me <sub>2</sub> <sup>+</sup>
418.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	NHMe <sub>3</sub> <sup>+</sup>
419.	2-di-Me-cPr	Cl	H	H	NMe <sub>4</sub> <sup>+</sup>
420.	2-di-Me-cPr	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
421.	2-Me-Vin	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
422.	2-Ph-Vin	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
423.	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
424.	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
425.	cBu	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
426.	cBu	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
427.	cBu	Br	H	H	Na <sup>+</sup>
428.	cBu	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
429.	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
430.	cHex	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
431.	cPr	F	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
432.	cPr	Cl	H	H	Li <sup>+</sup>
433.	cPr	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
434.	cPr	Cl	H	H	K <sup>+</sup>
435.	cPr	Cl	H	H	Ca <sup>2+</sup>
436.	cPr	Cl	H	H	Mg <sup>2+</sup>
437.	cPr	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
438.	cPr	Cl	H	H	NH <sub>3</sub> Me <sup>+</sup>
439.	cPr	Cl	H	H	NH <sub>2</sub> Me <sub>2</sub> <sup>+</sup>
440.	cPr	Cl	H	H	NHMe <sub>3</sub> <sup>+</sup>
441.	cPr	Cl	H	H	NMe <sub>4</sub> <sup>+</sup>
442.	cPr	Br	H	H	Na <sup>+</sup>
443.	cPr	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
444.	cPr	Cl	H	Ac	Na <sup>+</sup>
445.	cPr	Cl	H	Ac	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
446.	cPr	Cl	H	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	M <sup>⊕</sup>
447.	cPr	Cl	Me	Me	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
448.	Hex	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
449.	iPr	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
450.	iPr	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
451.	iPr	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
452.	Me	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
453.	PhCH <sub>2</sub>	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
454.	PhCH <sub>2</sub>	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
455.	tBu	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
456.	tBu	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
457.	Vin	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
458.	Vin	Cl	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
459.	Vin	Br	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
460.	cPr	NO <sub>2</sub>	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>
461.	tBu	Br	H	H	Na <sup>+</sup>
462.	cHex	Cl	H	H	Na <sup>+</sup>
463.	CF <sub>3</sub>	F	H	H	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup>

Physikalische Daten ausgewählter Verbindungen der Tabellen 1-4:

Bsp. Nr.	Daten
1.	7.99 (m, 2H), 7.62 (m, 3H), 7.40 (bs, 2H)
9.	8.41 (d, 2H), 8.28 (d, 2H), 7.16 (bs, 2H)
12.	7.91 (d, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.38 (bs, 2H), 2.40 (s, 3H)
20.	8.05 (dd, 2H), 7.46 (dd, 2H), 7.32 (bs, 2H)
29.	8.00 (d, 2H), 7.70 (d, 2H), 7.40 (bs, 2H)
33.	8.22 (d, 2H), 7.87 (bs, 2H), 7.48 (d, 2H)
41.	8.08 (d, 2H), 7.60 (d, 2H), 4.40 (bs, 2H), 2.98 (s, 3H)
43.	8.18 (d, 2H), 7.54 (d, 2H), 3.08 (s, 6H)
45.	8.21 (d, 2H), 7.98 (d, 2H), 7.27 (bs, 2H)

Bsp. Nr.	Daten
53.	7.94 (d, 2H), 7.82 (d, 2H), 7.17 (bs, 2H)
80.	7.85 (m, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.31 (bs, 2H)
82.	8.03 (s, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.28 (bs, 2H)
87.	8.49 (s, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.15 (bs, 2H)
104.	8.37 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 6.40 (bs, 2H)
107.	7.71 (bs, 2H), 7.62 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H)
110.	7.83 (t, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.70 (bs, 2H), 7.51 (d, 1H)
137.	7.60 (bs, 2H), 7.51 (s, 2H), 3.93 (s, 3H),
168.	7.65 – 7.30 (m, 6H)
174.	7.85 (bs, 2H), 7.61 (m, 3H)
186.	7.80 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.58 (bs, 2H)
200.	7.50 – 6.92 (m, 5H), 2.41 (s, 3H), 2.32 (s, 3H)
201.	8.00 – 7.60 (m, 3H), 7.53 (s, 1H), 7.33 (s, 1H)
204.	8.10 (bs, 2H), 7.94 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.39 (t, 1H), 2.28 (s, 3H)
205.	7.90 (m, 2H), 7.37 (m, 1H), 7.21 (bs, 2H), 2.30 (s, 3H)
206.	9.01 (s, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.27 (d, 1H), 7.72 (t, 1H), 6.49 (bs, 2H)
207.	7.85 (d, 1H), 7.71 (bs, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.52 (t, 1H)
208.	7.82 (d, 1H), 7.80 – 7.55 (m, 4H)
209.	7.70 (t, 1H), 7.08 (m, 2H), 2.34 (s, 3H)
236.	4.94 (bs, 2H)
248.	7.62 (bs, 2H), 2.23 (bs, 1H), 1.00 (m, 4H)
249.	12.40 (bs, 1H), 7.50 (bs, 2H), 2.12 (m, 1H), 1.01 (m, 4H)
253.	8.39 (bs, 2H), 1.98 (m, 1H), 1.09 (m, 4H)
265.	7.32 (bs, 2H), 2.90 (bs, 1H), 1.17 (d, 6H)
272.	7.66 (bs, 2H), 2.31 (s, 3H)
274.	7.57 (bs, 2H), 7.30 (m, 5H), 3.96 (bs, 2H)

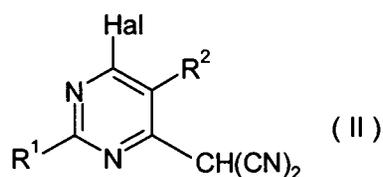
Bsp. Nr.	Daten
277.	7.30 (bs, 2H), 1.28 (s, 9H)
288.	8.08 (m, 2H), 7.55 (m, 3H), 7.23 – 6.92 (m, 6H)
296.	8.04 (d, 2H), 7.28 (d, 2H), 7.22 – 6.91 (m, 4H), 6.68 (bs, 2H), 2.35 (s, 3H)
304.	8.21 (d, 2H), 7.48 (d, 2H), 6.36 (bs, 2H)
308.	8.19 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 7.25 – 6.91 (m, 4H), 6.50 (bs, 2H)
309.	8.22 (d, 2H), 7.49 (m, 5H), 6.31 (bs, 2H), 2.38 (s, 3H)
310.	8.20 (d, 2H), 8.12 (bs, 2H), 7.48 (d, 2H), 6.36 (bs, 2H), 2.53 (s, 6H)
311.	9.28 (bs, 1H), 8.15 (d, 2H), 7.54 (d, 2H), 6.65 (bs, 2H), 2.78 (s, 9H)
312.	8.22 (d, 2H), 7.46 (d, 2H), 6.31 (bs, 2H), 3.09 (s, 12H)
318.	8.38 (d, 2H), 7.81 (d, 2H), 8.21 – 6.92 (m, 4H), 6.53 (bs, 2H)
332.	8.02 (m, 1H), 7.89 (m, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.22 – 6.93 (m, 4H), 6.53 (bs, 2H)
333.	8.09 (m, 2H), 7.55 (m, 2H), 7.23 – 6.93 (m, 4H), 6.86 (bs, 2H)
335.	8.61 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.22 – 6.92 (m, 4H), 6.59 (bs, 2H)
340.	8.41 (s, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.52 (d, 1H)
345.	7.81 (m, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.20 – 6.80 (m, 6H)
359.	7.49 (m, 2H), 7.32 (bs, 2H), 7.19 – 6.91 (m, 4H), 3.91 (s, 3H)
369.	7.60 – 7.40 (m, 4H), 7.20 – 6.92 (m, 4H)
371.	7.49 (m, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.22 – 6.92 (m, 4H), 6.57 (bs, 2H)
375.	7.62 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.21 – 6.90 (m, 4H),

Bsp. Nr.	Daten
	6.55 (bs, 2H)
381.	8.25 (d, 2H), 7.90 (d, 2H), 7.24 – 6.92 (m, 4H), 6.40 (bs, 2H)
383.	7.88 (m, 1H), 7.60 – 7.36 (m, 3H), 7.28 (m, 1H), 7.21 – 6.92 (m, 4H)
387.	7.51 (m, 1H), 7.21 – 6.91 (m, 4H), 6.42 (bs, 2H), 2.30 (s, 3H)
392.	7.75 (m, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.24 – 6.92 (m, 4H), 6.70 (bs, 2H)
454.	7.32 – 7.17 (m, 5H), 6.16 (bs, 2H), 3.64 (s, 2H)
461.	5.92 (bs, 2H), 1.17 (s, 9H)
463.	7.26 – 6.86 (m, 4H), 6.70 (bs, 2H)

Methode:  $^1\text{H-NMR}$  (Bruker DRX-400, 400 MHz, 294K, DMSO- $d_6$ , TMS = 0.0 ppm)

Tabelle 5: Verbindungen der Formel (II)

5



Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Hal
464.	Ph	Cl	F
465.	Ph	Br	F
466.	Ph	Cl	Cl
467.	Ph	Br	Cl
468.	Ph	Cl	Br
469.	Ph	Br	Br
470.	4-OMe-Ph	Cl	Cl
471.	4-OMe-Ph	Br	Cl

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Hal
472.	4-NO <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
473.	4-NO <sub>2</sub> -Ph	Br	Cl
474.	4-Me-Ph	Cl	Cl
475.	4-Me-Ph	Br	Cl
476.	4-I-Ph	Cl	Cl
477.	4-I-Ph	Br	Cl
478.	4-F-Ph	Cl	Cl
479.	4-F-Ph	Br	Cl
480.	4-Cl-Ph	Cl	Cl
481.	4-Cl-Ph	Br	Cl
482.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
483.	4-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	Cl
484.	4-Br-Ph	Cl	Cl
485.	4-Br-Ph	Br	Cl
486.	3-OMe-4-F-Ph	Cl	Cl
487.	3-OMe-4-F-Ph	Br	Cl
488.	3-Me-Ph	Cl	Cl
489.	3-Me-Ph	Br	Cl
490.	3-Me-4-Cl-Ph	Cl	Cl
491.	3-Me-4-Cl-Ph	Br	Cl
492.	3-F-Ph	Cl	Cl
493.	3-F-Ph	Br	Cl
494.	3-Cl-Ph	Cl	Cl
495.	3-Cl-Ph	Br	Cl
496.	3-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
497.	3-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	Cl
498.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	Cl
499.	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Br	Cl
500.	3,6-di-Cl-Ph	Cl	Cl
501.	3,6-di-Cl-Ph	Br	Cl

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Hal
502.	3,5-di-Cl-Ph	Cl	Cl
503.	3,5-di-Cl-Ph	Br	Cl
504.	3,5-di-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
505.	3,5-di-CF <sub>3</sub> -Ph	Br	Cl
506.	3,4-di-OMe-Ph	Cl	Cl
507.	3,4-di-OMe-Ph	Br	Cl
508.	3,4-di-Cl-Ph	Cl	Cl
509.	3,4-di-Cl-Ph	Br	Cl
510.	2-F-6-Cl-Ph	Cl	Cl
511.	2-F-6-Cl-Ph	Br	Cl
512.	2-F-4-Cl-Ph	Cl	Cl
513.	2-F-4-Cl-Ph	Br	Cl
514.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Cl	Cl
515.	2-F-4-Cl-5-OMe-Ph	Br	Cl
516.	2-F-4,5-di-Cl-Ph	Cl	Cl
517.	2-F-4,5-di-Cl-Ph	Br	Cl
518.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Cl	Cl
519.	2-F-3-SMe-4-Cl-Ph	Br	Cl
520.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	Cl
521.	2-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	Cl
522.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Cl	Cl
523.	2-F-3-OEt-4-Cl-Ph	Br	Cl
524.	2-F-3-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Cl	Cl
525.	2-F-3-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	Br	Cl
526.	2-F-3-NMe <sub>2</sub> -4-Cl-Ph	Cl	Cl
527.	2-F-3-NMe <sub>2</sub> -4-Cl-Ph	Br	Cl
528.	2-F-3-Me-4-Cl-Ph	Cl	Cl
529.	2-F-3-Me-4-Cl-Ph	Br	Cl
530.	2-Cl-Ph	Cl	Cl
531.	2-Cl-Ph	Br	Cl

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Hal
532.	2,6-di-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Cl	Cl
533.	2,6-di-F-3-OMe-4-Cl-Ph	Br	Cl
534.	2,6-di-Cl-Ph	Cl	Cl
535.	2,6-di-Cl-Ph	Br	Cl
536.	2,5-di-Cl-Ph	Cl	Cl
537.	2,5-di-Cl-Ph	Br	Cl
538.	2,4-di-F-5-OMe-Ph	Cl	Cl
539.	2,4-di-F-5-OMe-Ph	Br	Cl
540.	2,4-di-F-3-OMe-Ph	Cl	Cl
541.	2,4-di-F-3-OMe-Ph	Br	Cl
542.	2,4-di-Cl-Ph	Cl	Cl
543.	2,4-di-Cl-Ph	Br	Cl
544.	2,4-di-Cl-5-F-Ph	Cl	Cl
545.	2,4-di-Cl-5-F-Ph	Br	Cl
546.	2,4-di-Cl-3-OMe-Ph	Cl	Cl
547.	2,4-di-Cl-3-OMe-Ph	Br	Cl
548.	2,4,6-tri-Cl-Ph	Cl	Cl
549.	2,4,6-tri-Cl-Ph	Br	Cl
550.	1-Cl-cPr	Cl	Cl
551.	1-Cl-cPr	Br	Cl
552.	2-cPr-Vin	Cl	Cl
553.	2-cPr-Vin	Br	Cl
554.	2-di-Me-cPr	Cl	Cl
555.	2-di-Me-cPr	Br	Cl
556.	2-Me-Vin	Cl	Cl
557.	2-Me-Vin	Br	Cl
558.	2-Ph-Vin	Cl	Cl
559.	2-Ph-Vin	Br	Cl
560.	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Cl	Cl
561.	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Br	Cl

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Hal
562.	cBu	Cl	Cl
563.	cBu	Br	Cl
564.	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
565.	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
566.	cHex	Cl	Cl
567.	cHex	Br	Cl
568.	cPr	Cl	Cl
569.	cPr	Br	Cl
570.	Hex	Cl	Cl
571.	Hex	Br	Cl
572.	iPr	Cl	Cl
573.	iPr	Br	Cl
574.	Me	Cl	F
575.	Me	Br	F
576.	Me	Cl	Cl
577.	Me	Br	Cl
578.	Me	Cl	Br
579.	Me	Br	Br
580.	PhCH <sub>2</sub>	Cl	Cl
581.	PhCH <sub>2</sub>	Br	Cl
582.	tBu	Cl	Cl
583.	tBu	Br	Cl
584.	Vin	Cl	Cl
585.	Vin	Br	Cl
586.	2,4-di-Me-Ph	Cl	Cl
587.	2,4-di-F-Ph	Cl	Cl
588.	4-COOEt-Ph	Cl	Cl
589.	2-F-4-Me-Ph	Cl	Cl
590.	3-F-4-Me-Ph	Cl	Cl
591.	3-Me-4-F-Ph	Cl	Cl

Physikalische Daten ausgewählter Verbindungen der Tabelle 5:

Bsp. Nr.	Daten
472.	8.43 (d, 2H), 8.35 (d, 2H)
478.	8.25 (m, 2H), 7.30 (m, 2H)
480.	8.21 (d, 2H), 7.54 (d, 2H)
492.	8.19 – 8.14 (m, 2H), 7.59 – 7.48 (m, 2H)
494.	8.16 (m, 2H), 7.53 (m, 2H)
510.	7.51 (m, 1H), 7.41 (m, 1H), 7.33 (m, 1H)
534.	7.58 – 7.53 (d, 2H), 7.50 – 7.45 (m, 1H)
542.	7.68 (m, 2H), 7.50 (d, 1H)
576.	2.28 (s, 3H)
586.	7.67 (d, 1H), 7.07 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)
587.	7.98 (m, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.19 (m, 1H)
588.	8.33 (d, 2H), 8.05 (d, 2H), 4.35 (q, 2H), 1.33 (t, 3H)
589.	7.80 (m, 1H), 7.09 (m, 2H), 2.35 (s, 3H)
590.	7.94 (dd, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.38 (m, 1H), 2.29 (s, 3H)
591.	8.08 (m, 2H), 7.22 (m, 1H), 2.28 (s, 3H)

Methode:  $^1\text{H-NMR}$  (Bruker DRX-400, 400 MHz, 294K, DMSO- $d_6$ , TMS = 0.0 ppm)

5

#### B. Formulierungsbeispiele

- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer erfindungsgemäßen Verbindung, 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

15

- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykoether (@Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykoether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277 °C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- 5
- d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung, 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- 10
- e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Calcium, 5 Gew.-Teile Natriumlaurylsulfat, 3 Gew.-Teile Polyvinylalkohol und 7 Gew.-Teile Kaolin mischt, auf einer Stifmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.
- 15
- 20
- f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man 25 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung 5 Gew.-Teile 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium 2 Gew.-Teile oleoymethyltaurinsaures Natrium, 1 Gew.-Teil Polyvinylalkohol, 17 Gew.-Teile Calciumcarbonat und 50 Gew.-Teile Wasser auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.
- 25
- 30

### C. Biologische Beispiele

#### Herbizide Wirkung bzw. Kulturpflanzenverträglichkeit im Nachauflauf

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

- Wie die Ergebnisse in Tabelle 7 zeigen, weisen erfindungsgemäße Verbindungen eine gute herbizide Nachauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von
- 20 Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise hat die Verbindung Nr. 1 und andere Verbindungen aus den Tabellen 1 bis 4 sehr gute herbizide Wirkung von mindestens 80 % gegen Schadpflanzen wie *Matricaria inodora*, *Polygonum (Fallopia) convolvulus* und *Veronica persica* im Nachauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0.32 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar. Gleichzeitig lassen
- 25 erfindungsgemäße Verbindungen Gramineen-Kulturen wie Gerste, Weizen, Roggen, Hirse, Mais oder Reis im Nachauflaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch zweikeimblättrige Kulturen wie Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben oder Kartoffeln. Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen teilweise eine hohe
- 30 Selektivität und eignen sich deshalb im Nachauflaufverfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

## Herbizide Wirkung bzw. Kulturpflanzenverträglichkeit im Voraufbau

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen werden in Holzfasertöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in  
5 Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion in einer Aufwandmenge entsprechend 320 g / Hektar mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha unter Zusatz von 0,2% Netzmittel auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

10

Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Testpflanzen gehalten. Die visuelle Bonitur der Schäden an den Versuchspflanzen erfolgt nach einer Versuchszeit von 3 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen (herbizide Wirkung in Prozent  
15 (%): 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0 % Wirkung = wie Kontrollpflanzen).

Wie die Ergebnisse in Tabelle 6 zeigen, weisen erfindungsgemäße Verbindungen eine gute herbizide Voraufbauwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von  
20 Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise haben die Verbindungen Nr. 9 und andere Verbindungen aus den Tabelle 1 bis 4 sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie *Sinapis alba*, *Avena fatua*, *Stellaria media*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* und *Alopecurus myosuroides* im Voraufbauverfahren bei einer  
25 Aufwandmenge von 0,32 kg Aktivsubstanz pro Hektar. Gleichzeitig lassen erfindungsgemäße Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben oder Kartoffeln im Voraufbauverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie Gerste, Weizen, Roggen, Hirse, Mais oder Reis. Die  
30 erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen teilweise eine hohe Selektivität und eignen sich deshalb im Voraufbauverfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

Tabelle 6: Biologische Wirkung im Voraufbau

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	ALOMY	AMARE	LOLMU	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	VERPE	VIOTR	
9									80	90	
12	80		100						100		
29									100	80	
41					80					100	
110			100					80	100	90	
186			90						100		
202			90			100			100		
203			100						90		
205									100	100	
208	100		80					90	100		
210									80	100	
248					80	80			90		

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	ALOMY	AMARE	LOLMU	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	VERPE	VIOTR	
249	90		90		90	85	90		90	95	
296	80		100						100		
304			90		80			80	100		
308	80	80	100		90	95	90	90	100	100	
309			85						100	100	
310			100		80			90	100	100	
311	80		100		90			90	100	100	
312			95					90	100	100	
318							80		100		
321			90						100	100	
335					80				100	80	
345	90	80	90		80			80	100	80	
359	90		100	80	100			90	100		

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	ALOMY	AMARE	LOLMU	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	VERPE	VIOTR	
375			100						100	80	
387		80							100		
392			80						100	100	
455				80						100	

Abkürzungen:

- ABUTH Abutilon theophrasti
- ALOMY Alopecurus myosuroides
- 5 AMARE Amaranthus retroflexus
- LOLMU Lolium multiflorum
- MATIN Tripleurospermum inodorum
- PHBPU Ipomoea purpurea
- POLCO Polygonum convolvulus
- 10 SETVI Setaria viridis
- VERPE Veronica persica
- VIOTR Viola tricolor

Tabelle 7: Biologische Wirkung im Nachauflauf

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	AMARE	ECHCG	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR	
12	80	90	80	80		80			90		
29	80								90	80	
45				80		80	80		90	80	
87				90					90		
104	80	90	80	90		80	80		90	80	
110		90	80	90	80	95	80	90	90	90	
186	100	100		90		100		90	90	80	
201		90		80		90			90		
202	90	100	90	80		90					
204	90	90	80	80		80			80		
207	80	100		80		100		80	90		

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	AMARE	ECHCG	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR	
208	90	100		100	80	80		90	90	90	
210		90							80		
240	80			80					90		
248		80		80				80	90		
249	83	93	90	90	90	90		80	100	87	
265	80	100		90	100	90		90	90		
296	80	90	80	90					90		
300		80		80					80		
304	80	100		90		80		80		80	
308	93	100	88	93	90	100	87	92	97	88	
309	90	95	90	85		90	80	80	90	85	
310	85	95	90	85	80	85	80	80	87	90	
311	90	90	90	90		90	80	80	90	80	

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	AMARE	ECHCG	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR	
312	85	90	85	90		90	90	80	95	80	
313	80	100		90				90	100	80	
318	80			90		80			90		
321	90	100	90	100		100	80	80	90	90	
335		80		80							
340	80	90		90		90			90		
345		100		90		80		90	90	80	
359	80	100	90	90	80	90	80				
375	90	100		90		100			90		
383	80	90		90		100			90		
385	80	100		80		80					
387	90	100	90			100			80		
389	80	80				80			80		

Verbindung	Wirkung in % gegen angegebene Pflanze										
	ABUTH	AMARE	ECHCG	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR	
390		90				80			80		
391						80					
392	90	100	80	100		90	80	90	90	90	

Abkürzungen: siehe Tabelle 6, darüber hinaus:

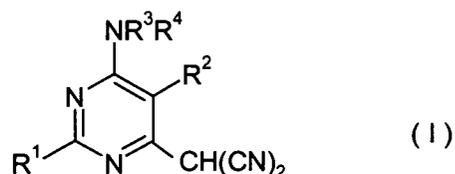
ECHCG Echinochloa crus-galli

STEME Stellaria media

## Patentansprüche

1. Verbindung der Formel (I) und deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze,

5



worin die Reste folgende Bedeutung aufweisen:

- 10 R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Hydroxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkinyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkinyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylsulfinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenylsulfinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxycarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Trialkylsilyl, Phenyl, Phenoxy oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Ring, jeder Phenyl-Ring, Phenoxy-Ring oder 5- oder 6-gliedrige heteroaromatische Ring optional substituiert mit 1-3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus R<sup>28</sup>; oder zwei benachbarte Reste R<sup>x</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -OCH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH(CH<sub>3</sub>)O-, -OC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>O-, -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O- oder -CH=CH-CH=CH-; oder

30

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Aryl bedeuten; oder

5

(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio bedeuten;

10 R<sup>2</sup> ist H, F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, OR<sup>5</sup>, SR<sup>6</sup> oder N(R<sup>7</sup>)R<sup>8</sup>; worin R<sup>5</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl ist, R<sup>6</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl ist und R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> unabhängig voneinander H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl sind;

15 R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>9</sup>, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>10</sup>, oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkinyl optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>11</sup>; oder R<sup>3</sup> ist C(=O)R<sup>12</sup>, NO<sub>2</sub>, OR<sup>13</sup>, S(O)<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, N(R<sup>15</sup>)R<sup>16</sup> oder N=C(R<sup>17</sup>)R<sup>18</sup>;

20 R<sup>4</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>9</sup>, oder C(=O)R<sup>12</sup>; oder R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, jede Gruppe optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>19</sup>; oder R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe =C(R<sup>20</sup>)N(R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup> oder =C(R<sup>23</sup>)OR<sup>24</sup>;

25 dabei ist jeder Rest R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkylthio, Amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Dialkylamino oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl;

R<sup>12</sup> ist jeweils unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy;

R<sup>13</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup>;

R<sup>14</sup> ist (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl;

30 R<sup>15</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder C(=O)R<sup>27</sup>;

R<sup>16</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

R<sup>17</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder Phenyl optional substituiert mit 1-3 Resten, welche

voneinander unabhängig CH<sub>3</sub>, Cl oder OCH<sub>3</sub> bedeuten;

R<sup>18</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>;

5 R<sup>19</sup> ist jeweils unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkylthio, Amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Dialkylamino oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl;

R<sup>20</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

10 R<sup>21</sup> und R<sup>22</sup> sind unabhängig voneinander H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>21</sup> und R<sup>22</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-;

R<sup>23</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

R<sup>24</sup> ist (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

R<sup>25</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy;

15 R<sup>26</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy;

R<sup>27</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) Alkyl oder Benzyl; und

20 R<sup>28</sup> ist jeweils unabhängig voneinander Halogen, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylcarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy-carbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylaminocarbonyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Trialkylsilyl.

25 2. Verbindung der Formel (I) und deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze gemäß Anspruch 1, worin die Reste folgende Bedeutung aufweisen:

30 R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxyalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkynyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino, -OCH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-,

-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-, -OCH(CH<sub>3</sub>)O-, -OC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>O-, -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O- oder -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, wobei die acht letztgenannten Substituenten jeweils durch zwei benachbarte R<sup>x</sup> gebildet werden; oder

- 5 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl; oder
- 10 (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkylthio;

R<sup>2</sup> ist H, F, Cl, Br, I, CN oder NO<sub>2</sub>;

15

R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, C(=O)R<sup>12</sup>, OR<sup>13</sup>, N(R<sup>15</sup>)R<sup>16</sup> oder N=C(R<sup>17</sup>)R<sup>18</sup>;

R<sup>4</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-2 Resten R<sup>9</sup>, oder C(=O)R<sup>12</sup>; oder

- 20 R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder =C(R<sup>20</sup>)N(R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>;

dabei ist jeder Rest R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkylthio, Amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Dialkylamino oder (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl;

25

R<sup>12</sup> ist jeweils unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy;

R<sup>13</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup>;

R<sup>15</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder C(=O)R<sup>27</sup>;

- 30 R<sup>16</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

R<sup>17</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder Phenyl optional substituiert mit 1-3 Resten, welche voneinander unabhängig CH<sub>3</sub>, Cl oder OCH<sub>3</sub> bedeuten;

R<sup>18</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe  
-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-;

R<sup>20</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl;

R<sup>21</sup> und R<sup>22</sup> sind unabhängig voneinander H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder R<sup>21</sup> and R<sup>22</sup>  
5 bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>- oder  
-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-;

R<sup>25</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder  
Benzyloxy; und

R<sup>26</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy.

10

3. Verbindung der Formel (I) und deren N-Oxide und agrochemisch geeignete  
Salze gemäß Anspruch 1 oder 2, worin die Reste folgende Bedeutung  
aufweisen:

R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig  
15 voneinander bedeuten Halogen, Carboxyl, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-  
C<sub>8</sub>)Dialkylamino,

-OCH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O- oder -OCH(CH<sub>3</sub>)O-, wobei die drei letztgenannten  
Substituenten jeweils durch zwei benachbarte R<sup>x</sup> gebildet werden; oder

20 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig  
voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy oder  
unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogene substituiertes Phenyl;  
oder

25 (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig  
voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy  
oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy;

R<sup>2</sup> ist F, Cl, Br, I oder NO<sub>2</sub>;

R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, C(=O)R<sup>12</sup>, worin R<sup>12</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-  
C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy ist,

30 oder OR<sup>13</sup>, worin R<sup>13</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup> ist,  
worin R<sup>25</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy  
oder Benzyloxy ist, und R<sup>26</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy ist;

R<sup>4</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.

4. Verbindung der Formel (I) und deren N-Oxide und agrochemisch geeignete  
5 Salze gemäß Anspruch 1 oder 2, worin die Reste folgende Bedeutung  
aufweisen:

R<sup>1</sup> ist Phenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>x</sup>, welche unabhängig  
voneinander bedeuten Halogen, Cyano, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl,  
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)Dialkylamino,  
10 -OCH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O- oder -OCH(CH<sub>3</sub>)O-; oder  
(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>y</sup>, welche unabhängig  
voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy; oder  
(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl, optional substituiert mit 1-3 Resten R<sup>z</sup>, welche unabhängig  
voneinander bedeuten Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkoxy  
15 oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)Haloalkoxy;

R<sup>2</sup> ist F, Cl, Br oder I;

R<sup>3</sup> ist H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkenyl, C(=O)R<sup>12</sup>, worin R<sup>12</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-  
C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy oder Benzyloxy ist,  
oder OR<sup>13</sup>, worin R<sup>13</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl oder CHR<sup>25</sup>C(O)OR<sup>26</sup> ist,  
20 worin R<sup>25</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, Phenyl, Phenoxy  
oder Benzyloxy ist, und R<sup>26</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy ist;

R<sup>4</sup> ist H oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl; oder

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> bilden gemeinsam eine Gruppe -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.

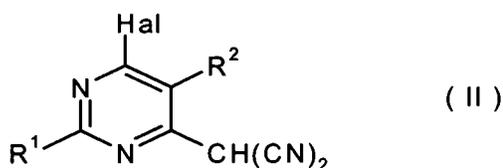
25 5. Agrochemisches Mittel, enthaltend a) mindestens eine Verbindung der Formel  
(I) oder deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze, wie in einem oder  
mehreren der Ansprüche 1 bis 4 definiert, und b) im Pflanzenschutz übliche Hilfs-  
und Zusatzstoffe.

30 6. Agrochemisches Mittel, enthaltend a) mindestens eine Verbindung der Formel  
(I) oder deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze, wie in einem oder  
mehreren der Ansprüche 1 bis 4 definiert, b) einen oder mehrere von Komponente a)

verschiedene agrochemische Wirkstoffe, und optional c) im Pflanzenschutz übliche Hilfs- und Zusatzstoffe.

7. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen oder zur  
5 Wachstumsregulierung von Pflanzen, wobei eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel (I) oder deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze, wie in einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 definiert, auf die Pflanzen, das Saatgut oder die Fläche, auf der die Pflanzen wachsen, appliziert wird.
- 10 8. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) oder deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze, wie in einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 definiert, als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.
9. Verwendung nach Anspruch 8, wobei die Verbindungen der Formel (I) oder  
15 deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung in Pflanzenkulturen eingesetzt werden.
10. Verwendung nach Anspruch 9, wobei die Kulturpflanzen transgene oder nicht  
20 transgene Kulturpflanzen sind.
11. Verfahren zur Herstellung einer Verbindung der Formel (I) oder deren N-Oxide und agrochemisch geeignete Salze, wie in einem oder mehreren der  
25 Ansprüche 1 bis 4 definiert, wobei man

a) eine Halogenverbindung der Formel (II)



30

mit einem Amin der Formel (III) HNR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> umgesetzt, wobei Hal ein Halogenatom

ist, die Reste  $R^1$ ,  $R^2$  in Formel (II) und  $R^3$ ,  $R^4$  in Formel (III) wie in Formel (I) in einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 definiert sind, und b) gegebenenfalls die in Schritt a) enthaltene Verbindung der Formel (I) nach üblichen Methoden in ein N-Oxid oder ein agrochemisch geeignetes Salz überführt.

5

12. Verbindung der Formel (II), worin die Reste  $R^1$  und  $R^2$  wie in Formel (I) in einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 definiert sind.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2010/001600

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
 INV. A01N43/54 C07D239/30 C07D239/42 A01P13/00  
 ADD.

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)  
 A01N C07D

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

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

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2005/063721 A (DU PONT [US]; CLARK DAVID ALAN [US]; FINKELSTEIN BRUCE LAWRENCE [US];) 14 July 2005 (2005-07-14) cited in the application page 10, line 16 - line 28 Table 1, Index Table A page 63, line 33 - line 36 page 22, line 15 - line 20	1-12
X	WO 2007/082076 A (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 19 July 2007 (2007-07-19) cited in the application pages 53-54; tables 1,2 page 21 - page 22	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 "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "&" document member of the same patent family
---	---

Date of the actual completion of the international search  <b>25 August 2010</b>	Date of mailing of the international search report  <b>03/09/2010</b>
--	---

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  <b>Lorusso, Patrizia</b>
--	--

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2010/001600

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 136 976 A (CIBA GEIGY AG [CH]) 10 April 1985 (1985-04-10) cited in the application page 23; examples 45-47 -----	1-4
X	DE 25 20 381 A1 (CIBA GEIGY AG) 20 November 1975 (1975-11-20) cited in the application Tabelle; pages 24-27 page 7 -----	1-3, 11, 12

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2010/001600

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005063721 A	14-07-2005	AR 046790 A1	21-12-2005
		AU 2004309325 A1	14-07-2005
		BR PI0417279 A	13-03-2007
		CA 2548058 A1	14-07-2005
		EC SP066645 A	25-10-2006
		EP 1694651 A1	30-08-2006
		JP 2007534649 T	29-11-2007
		KR 20060114345 A	06-11-2006
		MX PA06007033 A	31-08-2006
		NZ 547251 A	25-09-2009
		UY 28678 A1	31-08-2005
WO 2007082076 A	19-07-2007	AR 059009 A1	05-03-2008
		AU 2007204887 A1	19-07-2007
		CA 2626018 A1	19-07-2007
		CN 101360719 A	04-02-2009
		EP 1971579 A1	24-09-2008
		JP 4332589 B2	16-09-2009
		JP 2009519981 T	21-05-2009
EP 0136976 A	10-04-1985	JP 60072808 A	24-04-1985
DE 2520381 A1	20-11-1975	AT 344750 B	10-08-1978
		AU 498132 B2	15-02-1979
		AU 8105575 A	18-11-1976
		BE 828869 A1	10-11-1975
		CA 1042890 A1	21-11-1978
		CH 595061 A5	31-01-1978
		ES 437518 A1	01-01-1977
		FR 2270249 A1	05-12-1975
		GB 1501935 A	22-02-1978
		IL 47256 A	31-01-1979
		JP 50155624 A	16-12-1975
		NL 7505503 A	12-11-1975
		US 4014677 A	29-03-1977
		ZA 7502999 A	28-04-1976

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2010/001600

**A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
 INV. A01N43/54 C07D239/30 C07D239/42 A01P13/00  
 ADD.

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

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
 A01N C07D

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2005/063721 A (DU PONT [US]; CLARK DAVID ALAN [US]; FINKELSTEIN BRUCE LAWRENCE [US];) 14. Juli 2005 (2005-07-14) in der Anmeldung erwähnt Seite 10, Zeile 16 - Zeile 28 Table 1, Index Table A Seite 63, Zeile 33 - Zeile 36 Seite 22, Zeile 15 - Zeile 20	1-12
X	WO 2007/082076 A (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 19. Juli 2007 (2007-07-19) in der Anmeldung erwähnt Seiten 53-54; Tabellen 1,2 Seite 21 - Seite 22	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 naheliegend ist
- "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
25. August 2010	03/09/2010

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  Lorusso, Patrizia
--	--

## C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 136 976 A (CIBA GEIGY AG [CH]) 10. April 1985 (1985-04-10) in der Anmeldung erwähnt Seite 23; Beispiele 45-47 -----	1-4
X	DE 25 20 381 A1 (CIBA GEIGY AG) 20. November 1975 (1975-11-20) in der Anmeldung erwähnt Tabelle; Seiten 24-27 Seite 7 -----	1-3, 11, 12

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2010/001600

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2005063721 A	14-07-2005	AR 046790 A1	21-12-2005
		AU 2004309325 A1	14-07-2005
		BR PI0417279 A	13-03-2007
		CA 2548058 A1	14-07-2005
		EC SP066645 A	25-10-2006
		EP 1694651 A1	30-08-2006
		JP 2007534649 T	29-11-2007
		KR 20060114345 A	06-11-2006
		MX PA06007033 A	31-08-2006
		NZ 547251 A	25-09-2009
		UY 28678 A1	31-08-2005
		WO 2007082076 A	19-07-2007
AU 2007204887 A1	19-07-2007		
CA 2626018 A1	19-07-2007		
CN 101360719 A	04-02-2009		
EP 1971579 A1	24-09-2008		
JP 4332589 B2	16-09-2009		
JP 2009519981 T	21-05-2009		
EP 0136976 A	10-04-1985		
DE 2520381 A1	20-11-1975	AT 344750 B	10-08-1978
		AU 498132 B2	15-02-1979
		AU 8105575 A	18-11-1976
		BE 828869 A1	10-11-1975
		CA 1042890 A1	21-11-1978
		CH 595061 A5	31-01-1978
		ES 437518 A1	01-01-1977
		FR 2270249 A1	05-12-1975
		GB 1501935 A	22-02-1978
		IL 47256 A	31-01-1979
		JP 50155624 A	16-12-1975
		NL 7505503 A	12-11-1975
		US 4014677 A	29-03-1977
		ZA 7502999 A	28-04-1976